

(12) 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2004 年 10 月 21 日 (21.10.2004)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2004/089918 A1

(51) 国際特許分類: C07D 263/32, 417/14, 333/20, 413/12, 417/06, 409/12, 333/38, 333/16, 333/18, 277/22, 277/28, 417/12, A61K 31/421, 31/4439, 31/4725, 31/538, 31/497, 31/4184, 31/427, 31/428, 31/381, 31/405, 31/4155, 31/423, 45/00, A61P 43/00, 3/10, 3/06, 3/04

(21) 国際出願番号: PCT/JP2004/005119

(22) 国際出願日: 2004 年 4 月 9 日 (09.04.2004)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願2003-105267 2003 年 4 月 9 日 (09.04.2003) JP
特願2003-157590 2003 年 6 月 3 日 (03.06.2003) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 日本たばこ産業株式会社 (JAPAN TOBACCO INC.) [JP/JP]; 〒1058422 東京都港区虎ノ門二丁目 2 番 1 号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

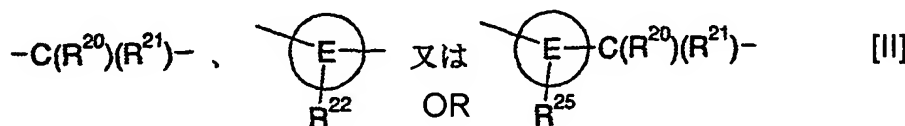
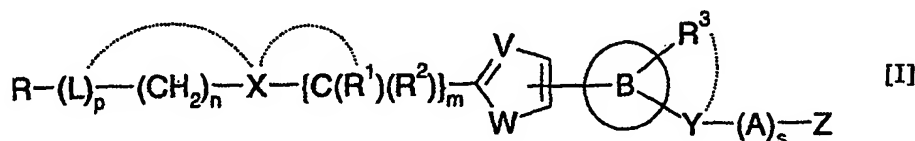
(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 池本 知之 (IKE-MOTO, Tomoyuki) [JP/JP]; 〒5691125 大阪府高槻市紫

町 1 番 1 号 日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所内 Osaka (JP). 田中 正浩 (TANAKA, Masahiro) [JP/JP]; 〒5691125 大阪府高槻市紫町 1 番 1 号 日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所内 Osaka (JP). 油納 健夫 (YUNO, Takeo) [JP/JP]; 〒5691125 大阪府高槻市紫町 1 番 1 号 日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所内 Osaka (JP). 坂本 丞平 (SAKAMOTO, Johei) [JP/JP]; 〒5691125 大阪府高槻市紫町 1 番 1 号 日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所内 Osaka (JP). 中西 博行 (NAKANISHI, Hiroyuki) [JP/JP]; 〒5691125 大阪府高槻市紫町 1 番 1 号 日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所内 Osaka (JP). 中川 祐一 (NAKAGAWA, Yuichi) [JP/JP]; 〒5691125 大阪府高槻市紫町 1 番 1 号 日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所内 Osaka (JP). 太田 毅 (OHTA, Takeshi) [JP/JP]; 〒5691125 大阪府高槻市紫町 1 番 1 号 日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所内 Osaka (JP). 坂田 昌平 (SAKATA, Shohei) [JP/JP]; 〒5691125 大阪府高槻市紫町 1 番 1 号 日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所内 Osaka (JP). 森長 寿代 (MORINAGA, Hisayo) [JP/JP]; 〒5691125 大阪府高槻市紫町 1 番 1 号 日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所内 Osaka (JP).

[続葉有]

(54) Title: HETEROAROMATIC PENTACYCLIC COMPOUND AND MEDICINAL USE THEREOF

(54) 発明の名称: 複素芳香 5 員環化合物及びその医薬用途



(57) Abstract: A heteroaromatic pentacyclic compound of the general formula: [I] [wherein V is CH or N; W is S or O; each of R¹ and R² is H, etc.; X is -N(R⁴), -O-, -S-, -SO₂-N(R⁵), -CO-N(R⁷), etc.; L is formula [II]; (Each of R²⁰, R²¹, R²² and R²⁵ is H, etc.; and E is an aryl or an aromatic heterocycle); R is -COOH, etc.; B is an aryl, etc.; R³ is H, etc.; Y is -C(R¹³)(R¹⁴)-N(R¹²)-, -C(R¹³)(R¹⁴)-O-, -N(R¹¹)-, -O-, etc.; A is an alkylene; Z is an aryl, etc.; etc.]. This compound or its prodrug or a pharmaceutically acceptable salt thereof has a protein tyrosine phosphatase 1B inhibiting activity and is useful as a curative medicine for diabetes mellitus, diabetes mellitus complications, hyperlipemia or obesity.

[続葉有]



(74) 代理人: 高島 一 (TAKASHIMA, Hajime); 〒5410044
大阪府大阪市中央区伏見町四丁目2番14号 藤村
大和生命ビル Osaka (JP).

(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が
可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR,
BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM,
DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,
ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS,
LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA,
NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE,
SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US,
UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が
可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL,
SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG,
KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY,
CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC,
NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG,
CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

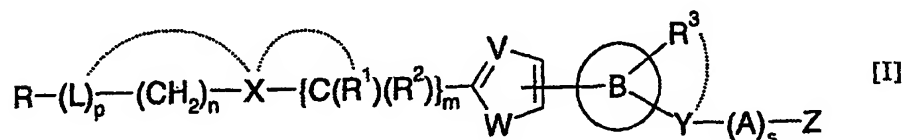
添付公開書類:

— 国際調査報告書
— 補正書・説明書

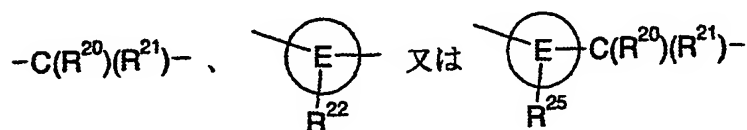
2文字コード及び他の略語については、定期発行される
各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語
のガイダンスノート」を参照。

(57) 要約:

一般式 [I]



[式中、VはCH又はN；WはS又はO；R¹及びR²はH等；Xは-N
(R⁴)-、-O-、-S-、-SO₂-N(R⁵)-、-CO-N(R⁷)
-等；Lは



(R²⁰、R²¹、R²²及びR²⁵はH等；Eはアリール又は芳香族ヘテロ環
基)；Rは-COOH等；Bはアリール等；R³はH等；Yは-C(R¹³)
(R¹⁴)-N(R¹²)-、-C(R¹³)(R¹⁴)-O-、-N(R¹¹)-、-
O-等；Aはアルキレン；Zはアリール等；等]で示される複素芳香5
員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る
塩は、蛋白質チロシンホスファターゼ1B阻害活性を有し、糖尿病、糖
尿病合併症、高脂血症、肥満症の治療薬として有用である。

明細書

複素芳香 5 員環化合物及びその医薬用途

技術分野

- 本発明は、新規な複素芳香 5 員環化合物に関するものであり、更に詳しくは蛋白質チロシンホスファターゼ 1 B (PTP1B; Protein Tyrosine Phosphatase 1B) 阻害活性を有する複素芳香 5 員環化合物又はその医薬上許容し得る塩、及びそれを含む有する医薬組成物に関する。

背景技術

- 10 糖尿病は、慢性的な高血糖状態を主徴とした様々な代謝異常を引き起こす疾患であり、口渇、多飲、多尿、体重減少等、高血糖に基づく様々な症状を示す。また、このような高血糖状態が長く続くと網膜症、腎症、神経障害、動脈硬化に基づく心筋梗塞や脳梗塞等のいろいろな合併症を起こすことも知られている。
- 15 糖尿病は大別すると、膵 β 細胞の損傷・破壊によって絶対的なインスリン欠乏を起こす I 型糖尿病 (IDDM; インスリン依存型糖尿病) と、インスリン抵抗性とインスリン分泌低下によって相対的なインスリン欠乏を起こす II 型糖尿病 (NIDDM; インスリン非依存型糖尿病)、及び遺伝子の異常や他の疾患等に伴い二次的に発症する特殊な糖尿病と、
- 20 妊娠糖尿病の四つの型に分けられ、また発症当初は、II 型糖尿病と診断された者の中には、経過と共に次第にインスリン分泌能が低下し、ついには I 型糖尿病に至る場合もある。

- 糖尿病に対しては、上記のような高血糖状態を改善し、さらには合併症の発症と進展を阻止するのが必須であることから、食事療法や運動療
- 25 法その他、さまざまな薬剤を使用して血糖値が正常範囲内になるようコントロールする治療が試みられてきている。代表的な既存の薬剤としては、インスリン製剤、膵 β 細胞からのインスリン分泌を促すインスリン分泌促進剤 (スルホニルウレア剤、スルホンアミド剤、フェニルアラニン誘導体等)、糖吸収を遅らせる α -グルコシダーゼ阻害剤、肝糖新生阻害作用を有するとされるが詳細な機序は不明なビッグアナイド剤、ペルオキシ
- 30 ソーム増殖因子活性化受容体 (PPAR; Peroxisome Proliferator-activated Receptor) 作動

剤作用を介して線維芽細胞から脂肪細胞への分化を促しインスリン感受能を有する細胞を数的に増加させるインスリン感受性増強剤（チアゾリジンジオン誘導体等）等が挙げられる。しかしながら、いずれもそれぞれ有効性や安全性の面での問題点（例えば、インスリン分泌促進剤における膵 β 細胞疲弊による二次無効、低血糖リスクや肥満助長、インスリン感受性増強剤における浮腫とそれに基づく心臓への悪影響、貧血、過食、肥満助長やノンレスポonderの存在等）を有しており、未だ十分な血糖コントロールを達成できるには至っていない。

ところで、生体の糖代謝をみると、生体のエネルギー源や構成成分となる材料は断続的に体内に取り込まれているのに対し、例えば脳は間断なくグルコースを消費している。このような状況の中で、血糖値はほぼ一定に保たれており、このような血糖調節を可能にしているのは、血糖調節に係わるホルモン、臓器での代謝、臓器間での糖質等のやりとりの相互作用である。その中でも、特に血糖調節に係わるホルモンであるインスリンの作用は重要であり、その障害、即ちインスリン抵抗性やインスリン分泌低下が、糖尿病に深く関与していると考えられている。

インスリンは膵 β 細胞から分泌されて、その標的細胞である骨格筋細胞や脂肪細胞の膜表面にある受容体型チロシンキナーゼであるインスリン受容体に結合した後、細胞内ドメインのチロシン残基が自己リン酸化される。その後、インスリン受容体の基質である IRS (insulin receptor substrate)、APS (adapter protein containing PH and SH2 domain) 等のチロシン残基がリン酸化され、 PI_3 キナーゼ-Akt 経路が活性化することによりグルコーストランスポーターを細胞膜上へと移行させグルコースの取り込みが起こり、血中の糖濃度が低下する。一方で、このインスリンによる細胞内シグナル伝達を負に調節するチロシン脱リン酸化を行うチロシンホスファターゼも存在し、その活性化を抑制している。このように、チロシンリン酸化がインスリン作用における中心的役割を担っているが、チロシンリン酸化がリン酸化酵素であるチロシンキナーゼと脱リン酸化酵素であるチロシンホスファターゼの活性のバランスによって決まることを考えれば、チロシンホスファターゼはチロシンキナーゼと共にインスリンシグナル伝達に直接的に関与する重

要な調節的役割を果たしていると考えられる。

現在、チロシンホスファターゼは大きな遺伝子ファミリーを形成し、70数種類以上のアイソザイムが報告されているが、その中でも蛋白質チロシンホスファターゼ1B (PTP1B; Protein Tyrosine Phosphatase 1B) がインスリンシグナル伝達
5 に関する主要なホスファターゼであると考えられている。特に、高ブドウ糖培養でPTP1Bの遺伝子発現が増加することを認め、その細胞内局在が変化しインスリン受容体やIRS-1のチロシンリン酸化が減少し、インスリン抵抗性を誘導すること (J. Biol. Chem., 1995年, 第270巻, p. 7724-7730; J. Biochem. (Tokyo), 1998年, 第123巻, p. 813-820)、PTP1Bの野生型の導入で糖輸送体GLUT4のトランスロケーションが
10 障害され、ホスファターゼ活性欠損ミュータントではその効果が認められなかったこと、更に、PTP1Bのノックアウトマウスでインスリン感受性が増強し、また高脂肪食に対して肥満抵抗性となること (Science, 1999年, 第283巻, p. 1544-1548)から、この酵素がインスリンのもたらすインスリン受容体活性化からグルコース取り込みに至る作用を増強させるための一つのターゲットとなり得る可能性がある。現に、チロシンホスファターゼ阻害薬として以前から知ら
15 れているバナジン酸が動物実験等においてインスリン様作用を示すことが認められている。

従って、このようなチロシンホスファターゼ、特にPTP1Bの活性化を抑制及び／又は阻害する薬物は、インスリン受容体活性化シグナルが脱リン酸化を介して負に調節されるのを阻害することによりグルコース
25 取り込みに至る作用を増強し、結果インスリン作用の直接的な増強に基づき血糖を低下させる新しいタイプの糖尿病治療薬となり得る。また、肥満症、神経変性疾患等、様々な疾病治療薬への応用も期待できる。

最近に至り、このように蛋白質チロシンホスファターゼを阻害することで糖尿病等の疾患の治療を行うことを目的とした化合物について種々の報告がなされている。
30

例えば、国際公開第00/17211号パンフレットには、PTP1B阻害作用を有するホスホン酸誘導体が開示されている。しかしながら、

同公報には本発明化合物のごとき構造を有する化合物の開示は勿論、それ
を示唆する旨の記載も見当たらない。

特表平 11-508919 号公報（米国特許第 5,770,620 号
明細書）には、蛋白質チロシンホスファターゼ阻害剤として有用なアリ
ールアクリル酸誘導体が開示されている。しかしながら、同公報には本
5 発明化合物のごとき構造を有する化合物の開示は勿論、それを示唆する
旨の記載も見当たらない。

国際公開第 98/27092 号パンフレット（米国特許第 6,080,
772 号明細書）には、蛋白質チロシンホスファターゼ阻害作用を有す
10 るチアゾール化合物が開示されている。しかしながら、同公報には本発
明化合物のごとき構造を有する化合物の開示は勿論、それを示唆する旨
の記載も見当たらない。

国際公開第 99/58522 号パンフレットにはナフト [2,3-
B] ヘテロアル-4-イル誘導体が、国際公開第 99/58511 号パ
15 ンフレットにはオキサ/チアゾール-アリール-カルボン酸誘導体が、
国際公開第 99/58521 号パンフレット及び米国特許第 6,110,
962 号明細書には 11-アリール-ベンゾ [B] ナフト [2,3-
D] フラン及び 11-アリール-ベンゾ [B] ナフト [2,3-D] チ
オフェン誘導体が、国際公開第 99/58518 号パンフレットにはビ
20 フェニル-オキゾ-酢酸誘導体が、国際公開第 99/61419 号パン
フレットには 2,3,5-置換ビフェニル誘導体が、国際公開第 99/
58520 号パンフレットにはビフェニル-スルホニル-アリール-カ
ルボン酸誘導体が、国際公開第 99/61435 号パンフレットにはベ
ンゾチオフェン、ベンゾフラン及びインドール誘導体が、米国特許第 6,
25 103,708 号明細書にはフラン、ベンゾフラン及びチオフェン誘導
体が、米国特許第 6,110,963 号明細書にはアリール-オキゾ-
酢酸誘導体が、米国特許第 6,001,867 号明細書には 1-アリー
ル-ジベンゾチオフェン誘導体が、米国特許第 6,057,316 号明
細書には 4-アリール-1-オキサ-9-チア-シクロペンタ [B] フ
30 ルオレン誘導体が、米国特許第 6,063,815 号明細書にはベンゾ
フェノン誘導体が、それぞれ蛋白質チロシンホスファターゼ阻害作用を
有するとして開示されている。しかしながら、これら公報には本発明化

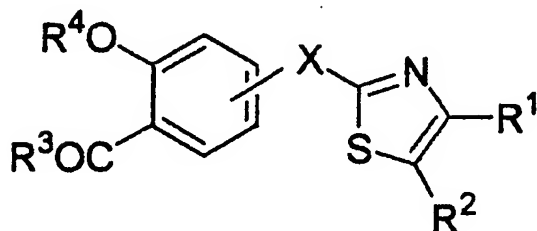
化合物のごとき構造を有する化合物の開示は勿論、それを示唆する旨の記載も見当たらない。

また、チアゾール、チオフェン又はオキサゾール構造を有する化合物として次のものが報告されている。

- 5 国際公開第00/45635号パンフレットには、2-置換チアゾール誘導体が記載されている。しかしながら、同公報の化合物は、チアゾール環の2位の置換基の末端にカルバモイル基を有するものであり、本発明化合物のごとき構造を有する化合物の開示もそれを示唆する旨の記載も見当たらない。また、同公報の化合物は抗菌剤、鎮痛剤として有用なものであり、PTP1B阻害剤としての有用性についての開示は勿論、それを示唆する記載も見当たらない。

- 特表2000-504039号公報には、2-アニリノ-4-フェニルチアゾール誘導体が記載されている。しかしながら、同公報の化合物は、チアゾール環の2位に水酸基又はカルボキシル基で置換されている
- 15 アニリノ基を、4位にフェニル基を有し、この4位のフェニル基の2位に置換基を有するものであり、本発明化合物のごとき構造を有する化合物の開示もそれを示唆する旨の記載も見当たらない。また、同公報の化合物はCRF (corticotropin releasing factor) アンタゴニストとして有用なものであり、PTP1B阻害
- 20 剤としての有用性についての開示は勿論、それを示唆する記載も見当たらない。

特開平4-154773号公報には、一般式



- 〔式中、R¹及びR²は同一又は異なって水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、フェニル基、置換フェニル基、ピリジル基又は置換ピリジル基を、R³は水酸基、低級アルコキシ基又は-N(R⁵)(R⁶) (式中、
- 25

R⁵ 及び R⁶ は同一又は異なって水素原子又は低級アルキル基を示す) で示される基を、R⁴ は水素原子又は低級アルキル基を、X はアミノ基、アミド基、カルボニル基、アルキレン基、酸素原子又は硫黄原子を示す] で示されるチアゾール誘導体が記載されている。しかしながら、同公報

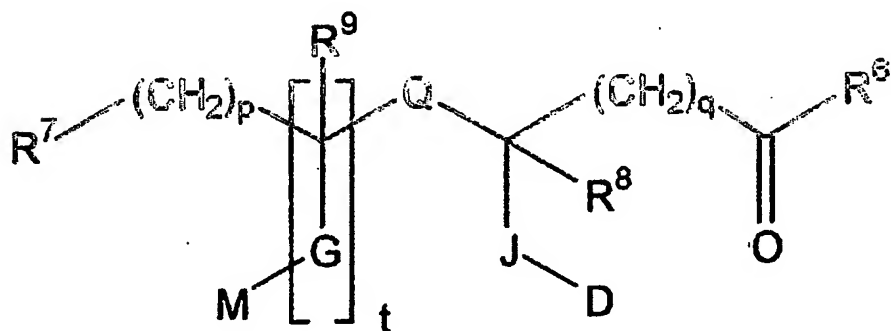
5 には、本発明化合物のごとき構造を有する化合物の開示はなく、それを示唆する旨の記載も見当たらない。また、同公報の化合物は、抗炎症剤として有用なものであり、P T P 1 B 阻害剤としての有用性についての開示は勿論、それを示唆する記載も見当たらない。

国際公開第 9 4 / 0 8 9 8 2 号パンフレットには、4-フェニルチア

10 ゾール誘導体が記載されている。しかしながら、同公報の化合物は、チアゾール環の 4 位にフェニル基を有し、この 4 位のフェニル基の 2 位にハロゲン等の置換基を有するものであり、本発明化合物のごとき構造を有する化合物の開示もそれを示唆する旨の記載も見当たらない。また、同公報の化合物は有害生物防除剤として有用なものであり、P T P 1 B

15 阻害剤としての有用性についての開示は勿論、それを示唆する記載も見当たらない。

国際公開第 0 2 / 3 9 9 9 7 号パンフレットには、一般式



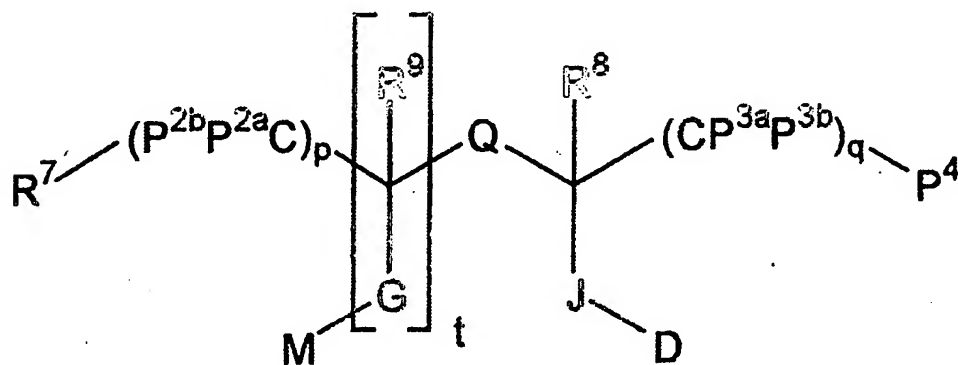
[式中、R⁶ は水酸基又は保護性プロドラッグ部位を、R⁷ は水素原子、

20 カルボキシ基、アリールアミノカルボニル基、アロイル基、アリール基、アルキルアミノカルボニル基、アミノカルボニル基、アルケニルアミノカルボキシ基、水酸基、アルコキシ基、エーテル、チオール、アミノ基含有ヘテロ環基又は保護性プロドラッグ部位を、R⁸ は D と結合して環を形成しても良い水素原子又はアルキル基を、R⁹ は低級アルキル基又は水

素原子を、Qは結合、酸素原子、硫黄原子、 CR^3OH 、 CR^3SH 、 $CR^3NR^{3a}R^{3b}$ 、 NR^3 、 $(CR^3R^{3a})_n$ 、 $O(CR^3R^{3b})_n$ 又は $(CR^3R^{3a})_nO(CR^3R^{3b})_n$ (式中、 n は0又は1乃至3の整数を示し、 R^3 、 R^{3a} 、 R^{3b} 及び R^{3c} はそれぞれ独立して水素原子、置換されてもよい直鎖、環状若しくは分枝鎖の C_{1-6} アルキル基、 C_{2-6} アルケニル基、アシル基、アリー

5 ルアルキル基、アリーロキシカルボニル基、アリーロアミノカルボニル基、アリーロアルキルスルホニル基又はアリーロ基を示す)を、Gは連結部位を、Mはアンカー部位を、Jは結合、アルキレン基、アルケニレン基又はアルキニレン基を、DはG、M又はQと結合して環を形成しても良い水素原子、アルコキシ基、アミン、アルキル基、アルケニル基、アルキニル基、アリーロ基又はヘテロアリーロ基を、 t は0又は1を、 p は0又は1乃至5の整数を、 q は0又は1乃至3の整数を示す]、並びに、

一般式



15

[式中、 P^4 はカルボキシ基、切断可能なプロドラッグ部位、 $COOP^4$ 、 $(CH_2)_{1-4}SP^4$ 又は $C(O)NP^4P^{4'}$ を、 R^7 は水素原子、カルボキシ基、置換されてもよい低級アルキルエステル、低級アルケニルエステル、低級アルキルで置換される第2アミンの付加したエステル、アリー

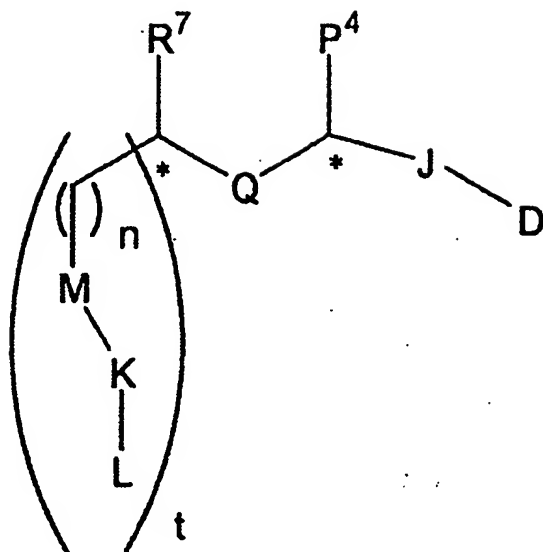
20 ルアミノカルボニル基、アロイル基、アリーロ基、アルキルアミノカルボニル基、アミノカルボニル基、 $COOR^7$ 、 $CONR^7R^{7'}$ 、水酸基、エーテル、チオール、アミノ基、 $(CH_2)_{1-4}SR^7$ 、ヘテロ環基又は切断可能なプロドラッグ部位を、 P^4 、 $P^{4'}$ 、 R^7 及び $R^{7'}$ はそれぞれ独立して水素原子、 C_{1-6} アルキル基、 C_{2-6} アルケニル基、 C_{2-6} アルキニル基又

は置換されてもよいアリール基を、 R^8 は水素原子、アルキル基又はDとの共有結合を、 R^9 は低級アルキル基又は水素原子を、Qは結合、酸素原子、硫黄原子、 CR^3OH 、 CR^3SH 、 $CR^3NR^{3a}R^{3b}$ 、 NR^3 、 $(CR^3R^{3a})_n$ 、 $O(CR^3R^{3b})_n$ 又は $(CR^3R^{3a})_nO(CR^{3b}R^{3c})_n$ (式中、nは
 5 0又は1乃至3の整数を示し、 R^3 、 R^{3a} 、 R^{3b} 及び R^{3c} はそれぞれ独立して水素原子、置換されてもよい C_{1-6} の直鎖若しくは分枝鎖アルキル基、 C_{2-6} の直鎖若しくは分枝鎖アルケニル基、アリールオキシカルボニル基、アリールアミノカルボニル基、アリールアルキルスルホニル基、アリールアルキル基、置換されてもよいアシル基、アリール基又は最大4のヘ
 10 テロ原子で置換されていてもよい C_{3-8} の環を示す)を、 P^{2a} 、 P^{2b} 、 P^{3a} 及び P^{3b} はそれぞれ独立して水素原子又は置換されてもよい直鎖、分枝鎖若しくは環状の C_{1-5} アルキル基を、Gは連結部位を、Mはアンカー部位を、Jは結合、アルキレン基、アルケニレン基又はアルキニレン基を示し、Dは水素原子、アルキル基、アルケニル基、アルキニル基若しくは
 15 アリール基を示すか又はG、M若しくはQと結合して環を形成しても良く、tは0又は1を、pは0又は1乃至5の整数を、qは0又は1乃至3の整数を示す]

で示される化合物が記載されており、

各一般式中のアンカー部位の例として $-NR'R''$ 、 $-CONR'R''$ 、 $-S$
 20 $(O)_2NR'R''$ 、 $-S(O)_{0-2}R'$ 、 $-NR'R''$ 、 $-O(CR'R'')_{0-2}CF_3$ 、 $-COR'$ 、 $-CO_2R'$ 若しくは $-OR'$ (式中、 R' 、 R'' はそれぞれ独立して水素原子、 C_{1-6} アルキル基、 C_{2-6} アルケニル基、 C_{2-6} アルキニル基又は置換されてもよいアリール基を示す)で置換されるアリール基又はヘテロアリール基を置換基として有するチアゾール基及びオキサ
 25 ズール基が、連結部位の例として共有結合及び C_{1-6} アルキル基が、それぞれ記載されている。

さらには、一般式



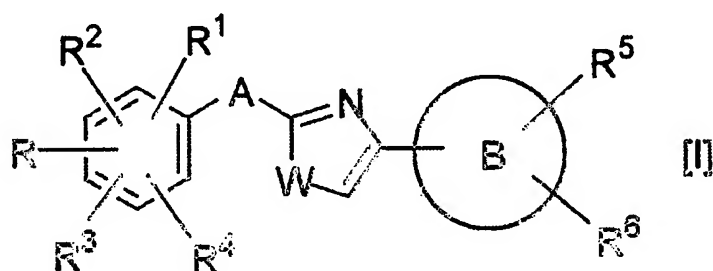
- 〔式中、Mは炭素環基、ヘテロ環基又はCONR⁷R^{7''}（式中、R⁷、R^{7''}はそれぞれ独立して水素原子、C₁₋₆アルキル基、C₂₋₆アルケニル基、C₂₋₆アルキニル基又は置換されてもよいアリール基を示す）を、Qは結合、
- 5 酸素原子、硫黄原子、CR³OH、CR³SH、CR³NR^{3a}R^{3b}、NR³、(CR³R^{3a})_n、O(CR³R^{3b})_n又は(CR³R^{3a})_nO(CR^{3b}R^{3c})_n（式中、nは0又は1乃至3の整数を示し、R³、R^{3a}、R^{3b}及びR^{3c}はそれぞれ独立して水素原子、置換されてもよい分枝鎖、環状若しくは直鎖のC₁₋₆アルキル基、C₂₋₆アルケニル基、アシル基、アリールアルキル基、アリールオキシカルボニル基、アリールアミノカルボニル基、アリールアルキルスルホニル基又はアリール基を示す）を、Kは独立して選択される副次連結部位を、Lは独立して選択される副次アンカー部位を、P⁴は水素原子、カルボキシ基、(CH₂)₁₋₄SP^{4'}、切断可能なプロドラッグ部位、COOP^{4'}又はCONP^{4'}P^{4''}を、R⁷は水素原子、カルボキシ基、アロイル基、アリール基、COOR⁷、C(O)NR⁷R^{7''}、水酸基、エーテル、チオール、(CH₂)₁₋₄SR⁷、ヘテロ環基又は切断可能なプロドラッグ部位を、P^{4'}、P^{4''}、R⁷及びR^{7''}はそれぞれ独立して水素原子、C₁₋₆アルキル基、C₂₋₆アルケニル基、C₂₋₆アルキニル基又は置換されてもよいアリール基を、nは0又は1乃至4の整数を、Dは水素原子、アルキル基、
- 20 アルコキシ基、アルケニル基、アミン、水酸基、アルキニル基、アリール基又はヘテロアリール基を、tは0又は1を示す〕で示される化合物

が記載されており、副次連結部位には共有結合を、副次アンカー部位には置換されてもよいアリール基を、それぞれ含むことが記載されている。

しかしながら、同公報には、本発明化合物のごとき構造を有する化合物の開示はなく、それを示唆する旨の記載も見当たらない。また、同公報の化合物は、アンジオテンシン変換酵素（ACE）-2調節剤として
5 有用なものであり、PTP1B阻害剤としての有用性についての開示は勿論、それを示唆する記載も見当たらない。

さらに、PTP1Bを阻害することで、糖尿病のみにとどまらず、高脂血症をも治療することを目的とした、チアゾール又はオキサゾール構
10 造を有する化合物の報告として、次のものがある。

特開2003-231679公報には、一般式



で表されるPTP1B阻害作用を有するアゾール化合物、並びに当該化合物が高脂血症治療薬として有用であることが開示されている。しかし
15 ながら、同公報の化合物は、置換基Aにて窒素原子若しくはカルボニル基がチアゾール若しくはオキサゾール2位の炭素原子と隣接するか又はアルキレンであること；Aとベンゼン環との結合；且つ置換基R⁶にて窒素原子、酸素原子、硫黄原子若しくはカルボニル基が環Bと隣り合うか、アルキレン又は単結合を経て環構造に至ることが必須との特徴を有して
20 おり、同公報には本発明化合物のごとき構造を有する化合物の開示はない。また、同公報には当該化合物のPTP1B阻害作用が他のタンパク質チロシンホスファターゼに対する作用に比べて高いことを示す記載はない。

また、糖尿病やその他の疾患の治療薬を複数組み合わせて使用する方法の報告として、次のものがある。
25

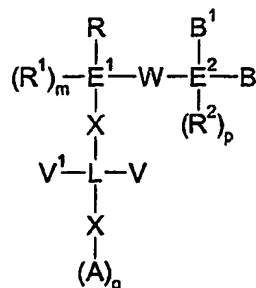
特開平 9-67271 公報には、インスリン感受性増強剤とインスリン製剤、インスリン分泌促進剤、 α -グルコシダーゼ阻害剤、ビッグアナイド剤等との組み合わせが開示されている。しかしながら、同公報には本発明のごとき PTP1B 阻害剤又は受容体型チロシンキナーゼネガティブ調節因子阻害剤の開示はなく、それを示唆する旨の記載も見当たらない。

国際公開第 WO 02/100846 号パンフレットには、一般式



〔式中、Mは、 $-SO_2-$ 、 $-C=O$ 、 $-C=S-$ 等から選択され； A^1 は、結合、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル等から選択され；Aは、 $COOR^5$ 、 $CO-COOR^5$ 、 $PO_3R^5R^5$ 等から選択され、ここで R^5 はそれぞれ独立して、水素原子及び C_{1-6} アルキルから選択され； R^1 及び R^2 は独立して、水素原子、 C_{1-6} アルキル、 C_{6-12} アリール等から選択され； R^3 は、 C_{6-12} アリール、 C_{3-10} ヘテロ環、 C_{6-12} アラルキル等から選択され；Yは、結合、 $-CH_2-$ 、 $-CO-$ 等から選択され；Zは、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル等から選択され； R^4 は、水素原子、ハロゲン、 CN 、 NO_2 等から選択される。〕を有するチオフェン誘導体化合物又はその塩が開示されている。

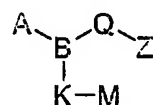
国際公開第 WO 02/34711 号パンフレットには、



25 〔式中、 E^1 及びLはそれぞれ独立して、飽和又は不飽和の5乃至7員炭素環、飽和又は不飽和の5乃至7員ヘテロ環、飽和又は不飽和の二環式

- 炭素環等から選択され；Rは、 $-\text{CH}=\text{C}-\text{R}^2-$ 、 $-\text{C}\equiv\text{C}-\text{R}^2$ 、 $-\text{C}(\text{R}^2)=\text{CH}$ 等から選択され；R¹は、水素原子、 $-\text{R}$ 、 $-\text{NO}_2$ 等から選択され；mは1又は1より多く；R²は、水素原子、ハロゲン、アルキル等から選択され；Wは、直接結合、 $-\text{CHR}^2-$ 、 $-\text{CH}=\text{CR}^2-$ 等から選択され；E²は、飽和又は不飽和の5乃至7員炭素環、飽和又は不飽和の5乃至7員ヘテロ環、二環系等から選択され；Xはそれぞれ独立して、直接結合、置換又は無置換のC₁₋₄メチレン鎖、O等から選択され、ここで、異なる位置にある該Xは同一又は異なってもよく；Bは、水素原子、 $-\text{H}$ 、 $-\text{CN}$ 等から選択され；B¹はBから選択され、
- 10 該B¹及びBは同一又は異なってもよく；pは、環の大きさに依存して1または1より多く；Aは、oが1である場合はR¹から選択され、但し、Lが、原子数が5より多い環である場合、oは環の大きさに依存して1または1より多く；V及びV¹はそれぞれ独立して、R¹及びカルボキサミジル(CONHR)で置換されたN-アルキルから選択され、こ
- 15 こで該アルキル基は直鎖、分枝鎖、環状、又は二環式等であってもよく；及びnは0乃至4である。)を有するチオフェン誘導体化合物が開示されている。

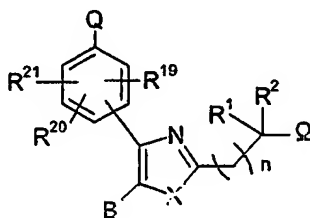
国際公開第WO 98 / 28264号パンフレットには、下式



20

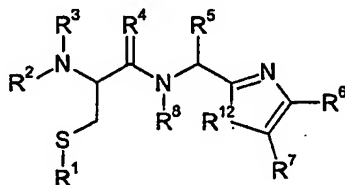
- [式中、BはNであり；Aは、C₁₋₆アルキルスルホニル、C₃₋₇シクロアルキルスルホニル、C₃₋₇シクロアルキル-C₁₋₆アルキルスルホニルから選択され、これらはそれぞれヒドロキシ基、C₁₋₄アルキル又はハロゲン原子で一、二又は三置換されていてもよく；
- 25 Qは-C₂₋₈アルキレン-W-C₁₋₃アルキレン-又は-C₃₋₈アルキレン-であり、ここで該-C₃₋₈アルキレン-は、フッ素原子、C₁₋₄アルキル、 $-\text{X}-\text{C}_{1-5}$ アルキレン-等から独立して選択される4までの置換基で置換されていてもよく、ここでXは、酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から独立して選択される1又は2個のヘテロ原子を有していてもよ
- 30 い5又は6員芳香環であり；Zは、カルボキシル、C₁₋₆アルコキシカル

- ボニル、テトラゾリル等であり；Kは、結合、 C_{1-8} アルキレン、チオ
 (C_{1-4}) アルキレン等であり、ここで該 C_{1-8} アルキレンは一置換され
 てもよく、また該Kは、フッ素原子、メチル又は塩素原子で一、二
 又は三置換されていてもよく；及びMは、 $-Ar$ 、 $-Ar^1-V-AP$ 、
 5 $-Ar^1-S-AP$ 等であり、ここで Ar 、 Ar^1 及び AP はそれぞれ独
 立して、酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選択される1乃至4個の
 ヘテロ原子を有していてもよい、部分飽和、全部飽和又は全部不飽和の
 5乃至8員環から選択される。]を有するチオフェン誘導体化合物若しく
 はその医薬上許容される塩又はそのプロドラッグが開示されている。
- 10 さらに、国際公開第WO 01/26656号パンフレット（特開20
 03-511416号公報）には、下式



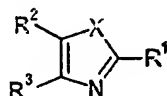
- 〔式中、 Ω は、 $-NR^{46}R^{47}$ 又は $-OR^{48}$ であり、ここで、 R^{46} 及び
 R^{47} はそれぞれ独立して、水素原子、アルキル、シクロアルキル等から
 15 選択され、 R^{48} は、水素原子、アルキル、アルキニル等から選択され；
 B は、水素原子又はアルキルであり； Q は、水素原子、 $-OR^{22}$ 、 $-S$
 R^{22} 等から選択され、ここで、 R^{22} は、水素原子、アルキル、アルキル、
 水酸基、ハロゲン原子等で置換されていてもよいアリール等から選択さ
 れ； R^{19} 、 R^{20} 及び R^{21} はそれぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、
 20 ヒドロキシ基等から選択され； X は、 NH 又は S であり； N は、0乃至
 6であり； R^1 及び R^2 は、それぞれ水素原子、アルキル及びシクロアル
 キルから選択される。〕を有する化合物が開示されている。

国際公開第WO 97/30053号パンフレットには、下式

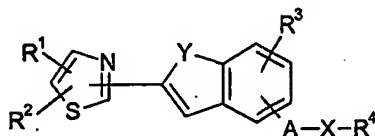


〔式中、 R^1 は、水素原子、低級アルキル、シクロアルキルチオ又は低級アルキルチオであり、 R^2 及び R^3 はそれぞれ独立して、水素原子又は低級アルキルであり；又は R^1 及び R^2 は、 $-CH_2-$ 、 $-CO-$ 又は $-C(CH_3)_2-$ を形成してもよく； R^4 は、 H 又は O であり； R^5 は、水素原子、置換又は無置換の低級アルキル、低級アルケニル等から選択され； R^6 及び R^7 はそれぞれ独立して、水素原子、 $-C(O)NHCHR^1$ 、 CO_2R^{14} 、置換又は無置換の低級アルキル等から選択され、ここで、 R^{13} は、置換又は無置換の低級アルキル等から選択され、 R^{14} は、水素原子又は低級アルキルであり、又は R^6 及び R^7 はアリール又はヘテロシクリルを形成してもよく； R^8 及び R^9 はそれぞれ独立して、水素原子、置換又は無置換の低級アルキル、シクロアルキル等から選択され、及び、 R^{12} は、 NR^9 、 S 又は O である。〕を有する化合物又はその医薬上許容される塩が開示されている。

国際公開第WO 99/21555号パンフレット及び特開2000-302680号公報 には、下式



〔式中、 R^1 は、水素原子、置換されていてもよい炭化水素基、置換されていてもよい複素環基から選択され； R^2 及び R^3 の少なくとも1つは、水素原子、置換されていてもよいピリジル又は置換されていてもよい芳香族炭化水素基であり、他方は置換されていてもよいピリジルであり；及び、 X は、酸化されていてもよい硫黄原子、酸素原子又は式 NR^4 で示される基であり、ここで、 R^4 は、水素原子、置換されていてもよい炭化水素基又はアシルである。〕を有する化合物又はその塩（これらはN-酸化されていてもよい。）が開示されている。



特開平5-202040号公報には、下式

〔式中、 R^1 は、置換されていてもよいアルキル、シクロアルキル、トリシクロアルキル又は置換されていてもよいアリールヘテロ環基であり；及び R^2 は、水素原子又はハロゲン原子であり、又は R^1 及び R^2 は、隣接する原子と一緒にあって、シクロアルケン環又はN含有ヘテロ環を形成してもよく； R^3 は、水素原子、ハロゲン原子、OH等から選択され； R^4 は、水素原子、アシル基、CN等から選択され；Aは、アルキレン、アルケニレン又は単結合であり；Xは、単結合、O又はSであり；及びYは、O又はSである。〕を有する化合物又はその塩が開示されている。

しかしながら、これらの公報のいずれにも、本発明のごとき構造を有する化合物の開示はもちろん、それを示唆する旨の記載も見当たらない。

本発明の目的は、優れた選択的PTP1B阻害作用及びそれに基づく受容体型チロシンキナーゼネガティブ調節因子阻害作用を有し、糖尿病治療薬、高脂血症、肥満症又は糖尿病合併症治療薬、神経変性疾患等の疾患の治療薬として有用な化合物を提供することである。

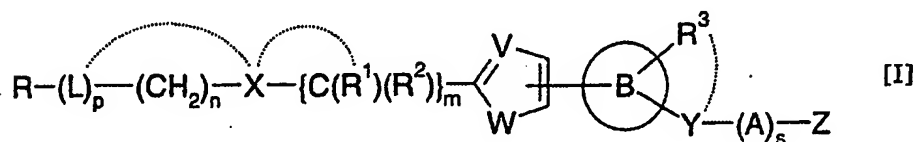
また、本発明の目的は、PTP1B阻害剤、糖尿病治療薬、高脂血症治療薬、肥満症治療薬又は糖尿病合併症治療薬を提供することである。

発明の開示

本発明者らは、上記目的を達成するために鋭意研究を重ねた結果、下記一般式〔I〕で示される複素芳香5員環化合物が、高いPTP1B阻害活性を示し、なおかつそれに比し他の蛋白質チロシンホスファターゼに対する阻害活性は低く、すなわち従来の化合物にはない優れた選択的PTP1B阻害作用を有し、PTP1B阻害剤、糖尿病治療薬、高脂血症治療薬、肥満症治療薬又は糖尿病合併症治療薬として有用であることを見出し、本発明を完成するに至った。

本発明は下記〔1〕乃至〔113〕に示す化合物及びその医薬用途に関する。

〔1〕 一般式〔I〕



〔式中、

Vは=N-又は=CH-を示し；

Wは-S-又は-O-を示し；

mは0、1又は2を示し；

5 R^1 及び R^2 は、それぞれ独立して、水素原子又は C_{1-4} アルキル基を示し；

Xは-N(R^4)-、-N(R^5)-CO-O-、-SO₂-N(R^5)-、
-N(R^5)-SO₂-、-N(R^6)-SO₂-N(R^5)-、-CO-N
(R^7)-、-N(R^8)-CO-、-N(R^9)-CO-N(R^5)-、-
10 N(R^{10})-(CH₂)_k-N(R^5)-、-N(R^{10})-(CH₂)_k-N(R^5)-CO-、-C(R^{10})=N-N(R^7)-、-N(R^{10})-(CH
2)_k-CH(R^6)-、-O-、-S-又は-SO₂-
(式中、

kは0又は1乃至4の整数を示し、

R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 及び R^{10} は、それぞれ独立して、

15 (1)水素原子、

(2) C_{1-6} アルキル基

(当該 C_{1-6} アルキル基は

(a)置換されてもよいアリール基、

(b)置換されてもよい芳香族ヘテロ環基、

20 (c)カルボキシ基、

(d) C_{1-4} アルコキシカルボニル基、

(e)-CO-N(R^{15})(R^{16})

(式中、 R^{15} 及び R^{16} は、それぞれ独立して、水素原子、置換されてもよいアリール基、置換されてもよい芳香族ヘテロ環基、 C_{1-6} アルキル基

25 (当該 C_{1-6} アルキル基は置換されてもよいアリール基、置換されてもよい芳香族ヘテロ環基、アリール基で置換されてもよい C_{1-4} アルコキシ基及び置換されてもよいアリールオキシ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい)を示すか、又はそれらが結合する窒素原子と一緒にあって、インドリン環を形成してもよく、若しくはさらに窒素
30 原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択される少なくとも1つのヘテロ原子を含有してもよい5乃至7員ヘテロ環を形成してもよい)、

(f)-N(R^{15})(R^{16})

(式中、 R^{15} 及び R^{16} は前記記載の通りである)、



- (式中、 R^{17} は水素原子、置換されてもよいアリール基、置換されてもよい芳香族ヘテロ環基又は C_{1-6} アルキル基 (当該 C_{1-6} アルキル基は置換されてもよいアリール基、置換されてもよい芳香族ヘテロ環基、アリール基で置換されてもよい C_{1-4} アルコキシ基及び置換されてもよいアリールオキシ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい) を示す)、

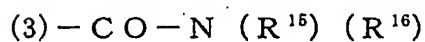


- 10 (式中、 R^{17} は前記記載の通りである)、

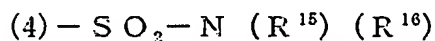


(式中、 R^{17} は前記記載の通りである) 又は

(j) C_{3-7} シクロアルキル基で置換されていてもよい)、



- 15 (式中、 R^{15} 及び R^{16} は前記記載の通りである)、



(式中、 R^{15} 及び R^{16} は前記記載の通りである)、



(式中、 R^{17} は前記記載の通りである)、

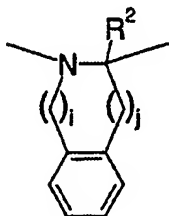
- 20 (6) $- SO_2 - R^{17}$

(式中、 R^{17} は前記記載の通りである)、

(7) 置換されてもよいアリール基、

(8) 置換されてもよい芳香族ヘテロ環基を示すか、又は

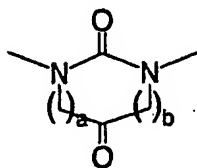
(9) R^4 及び R^1 が一緒になって



25

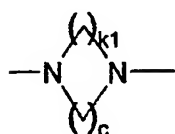
(式中、 i 及び j は、それぞれ独立して、0、1 又は 2 を示し、 R^2 は前記記載の通りである) を形成してもよく、

(10) R^5 及び R^9 が一緒になって



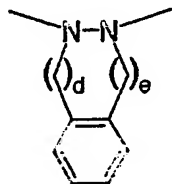
(式中、 a 及び b は、それぞれ独立して、0、1 又は 2 を示す) を形成してもよく、

5 (11) R^5 及び R^{10} が一緒になって



(式中、 $k1$ 及び c は、それぞれ独立して、0 又は 1 乃至 4 の整数を示す) を形成してもよく、

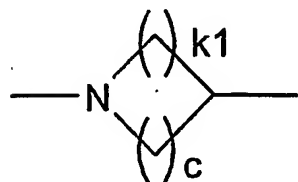
(12) R^5 及び R^{10} が一緒になって



10

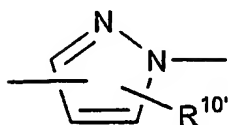
(式中、 d 及び e は、それぞれ独立して、0、1 又は 2 を示す) を形成してもよく、

(13) R^6 及び R^{10} が一緒になって



15 (式中、 $k1$ 及び c は前記記載の通りである) を形成してもよく、若しくは

(14) R^7 及び R^{10} が一緒になって



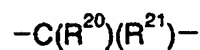
(式中、 R^{10} は水素原子又は C_{1-6} アルキル基を示す) を形成してもよい) を示し;

n は 0 又は 1 乃至 4 の整数を示し;

5 p は 0 又は 1 を示し;

L は

(1)



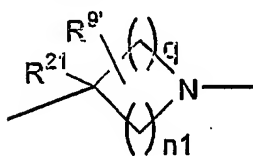
(式中、

10 R^{20} は

(a) 水素原子、

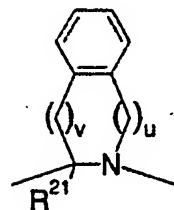
(b) C_{1-6} アルキル基を示すか、又は

(c) R^4 又は R^8 と一緒になって



15 (式中、 n_1 及び q は、それぞれ独立して、0 又は 1 乃至 4 の整数を示し、 R^9 は水素原子、水酸基、 C_{1-6} アルキル基、カルボキシ基又は C_{1-6} アルコキシ基を示す) を形成してもよく、若しくは

(d) R^4 と一緒になって

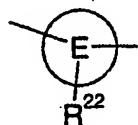


20 (式中、 u 及び v は、それぞれ独立して、0、1 又は 2 を示す) を形成してもよく、

R^{21} は水素原子、 C_{1-6} アルキル基 (当該 C_{1-6} アルキル基は置換されてもよいアリール基又は置換されてもよい芳香族ヘテロ環基で置換されてい

てもよい)、置換されてもよいアリール基又は置換されてもよい芳香族ヘテロ環基を示す)、

(2)



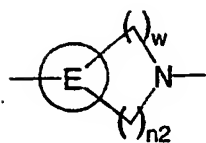
5 (式中、

Eはアリール基又は芳香族ヘテロ環基を示し、

R²²は

- (a)水素原子、
- (b)ハロゲン原子、
- 10 (c) C₁₋₄アルキル基、
- (d)カルボキシ基で置換されてもよいC₁₋₄アルコキシ基、
- (e) C₁₋₆アルキルチオ基、
- (f)ニトロ基、
- (g) -N (R²³) (R²⁴)

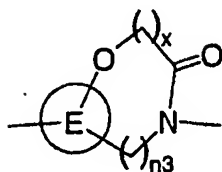
- 15 (式中、R²³及びR²⁴は、それぞれ独立して、水素原子、C₁₋₆アルキル基、C₁₋₄アルキルカルボニル基(当該C₁₋₄アルキルカルボニル基はアミノ基、C₁₋₄アルキルアミノ基又はジ(C₁₋₄アルキル)アミノ基で置換されていてもよい)又はC₁₋₄アルキルスルホニル基を示す)を示すか、又は
- (h) R⁴と一緒にって



20

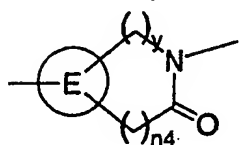
(式中、n₂及びwは、それぞれ独立して、0又は1乃至3の整数を示し、Eは前記記載の通りである)を形成してもよく、

(i) R⁴と一緒にって



(式中、 n_3 及び x は、それぞれ独立して、0 又は 1 を示し、 E は前記記載の通りである) を形成してもよく、

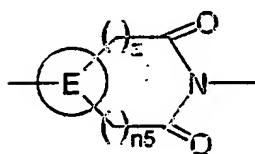
(j) R^7 と一緒になって



5

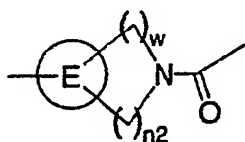
(式中、 n_4 及び y は、それぞれ独立して、0、1 又は 2 を示し、 E は前記記載の通りである) を形成してもよく、

(k) R^7 と一緒になって



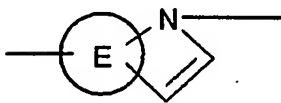
10 (式中、 n_5 及び z は、それぞれ独立して、0 又は 1 を示し、 E は前記記載の通りである) を形成してもよく、

(l) R^8 と一緒になって



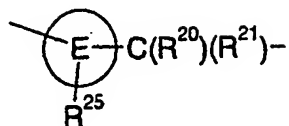
(式中、 n_2 及び w は、それぞれ独立して、0 又は 1 乃至 3 の整数を示し、
15 E は前記記載の通りである) を形成してもよく、若しくは

(m) R^4 と一緒になって



(式中、 E は前記記載の通りである) を形成してもよく、又は、

(3)



(式中、

 R^{20} 、 R^{21} 及び E は前記記載の通りであり、5 R^{25} は

(a) 水素原子、

(b) ハロゲン原子、

(c) C_{1-4} アルキル基、(d) カルボキシ基で置換されてもよい C_{1-4} アルコキシ基、10 (e) C_{1-6} アルキルチオ基、

(f) ニトロ基又は

(g) $-N(R^{23})(R^{24})$ (式中、 R^{23} 及び R^{24} は前記記載の通りである) を示し； R は $-COO(R^{19})$ 、 $-A^1-COO(R^{19})$ 又は $-O-A^1-COO(R$ 15 $^{19})$ (式中、 A^1 は C_{1-4} アルキレン基を示し、 R^{19} は水素原子又は C_{1-4} アルキル基を示す) を示し； B はアリール基又は芳香族ヘテロ環基を示し； R^3 は

20 (1) 水素原子、

(2) ハロゲン原子、

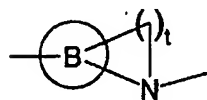
(3) C_{1-8} アルキル基、(4) C_{1-6} アルコキシ基、(5) C_{1-6} アルキルアミノ基、25 (6) ジ (C_{1-6} アルキル) アミノ基、

(7) シアノ基、

(8) ニトロ基、

(9) C_{1-4} ハロアルキル基、(10) $-S-R^{18}$ (R^{18} は C_{1-6} アルキル基又はアリール基を示す)、

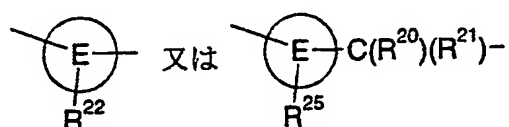
- (11) $-SO-R^{18}$ (R^{18} は C_{1-6} アルキル基又はアリール基を示す)、
 (12) $-SO_2-R^{18}$ (R^{18} は C_{1-6} アルキル基又はアリール基を示す)、
 (13) アリール基又は
 (14) ヘテロ環基を示し；
- 5 Y は $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-N(R^{11})-$ 、 $-N(R^{12})-$ 、 $-CO-$ 、 $-N(R^{12})-SO_2-$ 、 $-SO_2-N(R^{12})-$ 、 $-C(R^{13})(R^{14})-$ 、 $-CO-$ 、 $-C(R^{13})(R^{14})-N(R^{12})-$ 、 $-CO-N(R^{12})-$ 又は $-C(R^{13})(R^{14})-O-$
 (式中、
- 10 R^{11} は
 (1) 水素原子、
 (2) C_{1-3} アルキル基
 (当該 C_{1-8} アルキル基は
 (a) C_{3-7} シクロアルキル基、
 15 (b) 置換されてもよいアリール基、
 (c) 置換されてもよいヘテロ環基、
 (d) 水酸基、
 (e) C_{1-4} アルキルアミノ基及び
 (f) ジ (C_{1-4} アルキル) アミノ基からなる群より選択される置換基で置
 20 換されていてもよい)、
 (3) C_{2-4} アルケニル基、
 (4) C_{1-4} アルキルスルホニル基、
 (5) C_{1-4} アルキルカルボニル基
 (当該 C_{1-4} アルキルカルボニル基は水酸基又は C_{1-4} アルコキシ基で置換
 25 されていてもよい) を示すか、又は
 (6) R^3 と一緒になって



(式中、 t は 1 乃至 4 の整数を示し、 B は前記記載の通りである) を形成してもよく、

- 30 R^{12} は

- (1) 水素原子、
 (2) C_{1-8} アルキル基
 (当該 C_{1-8} アルキル基は
 (a) C_{3-7} シクロアルキル基、
 5 (b) 置換されてもよいアリール基、
 (c) 置換されてもよいヘテロ環基、
 (d) 水酸基、
 (e) C_{1-4} アルキルアミノ基及び
 (f) ジ (C_{1-4} アルキル) アミノ基からなる群より選択される置換基で置
 10 換されていてもよい)、
 (3) C_{2-4} アルケニル基、
 (4) C_{1-4} アルキルスルホニル基又は
 (5) C_{1-4} アルキルカルボニル基
 (当該 C_{1-4} アルキルカルボニル基は水酸基又は C_{1-4} アルコキシ基で置換
 15 されていてもよい) を示し、
 R^{13} 及び R^{14} は、それぞれ独立して、水素原子、 C_{1-4} アルキル基を示すか、
 又はそれらが結合する炭素原子と一緒になって C_{3-7} シクロアルカンを形
 成してもよく、若しくはそれらが結合する炭素原子と一緒になって、さ
 らに窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択される少なく
 20 とも 1 つのヘテロ原子を含有してもよい 5 乃至 7 員ヘテロ環を形成して
 もよい) を示し
 (但し、
 m が 0 であり、 p が 1 であり、 L が



- 25 (式中、 R^{20} 及び R^{21} はそれぞれ水素原子を示し、 E はフェニル基を示し、
 R^{22} は水素原子、ハロゲン原子、 C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基又
 はニトロ基を示し、 R^{25} は水素原子、ハロゲン原子、 C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基又はニトロ基を示す) である場合には、
 Y は、

—C(R¹³)(R¹⁴)—N(R¹²)—、—CO—N(R¹²)—又は—C(R¹³)(R¹⁴)—O—(式中、R¹²、R¹³及びR¹⁴は前記記載の通りである)である)；

sは0又は1を示し；

- 5 AはC₃₋₇シクロアルキル基で置換されてもよいC₁₋₄アルキレン基を示し；

Zは

(1) C₃₋₇シクロアルキル基

- (当該C₃₋₇シクロアルキル基はアリール基(当該アリール基はハロゲン原子又はC₁₋₆アルキル基で置換されてもよい)又は芳香族ヘテロ環基(当該芳香族ヘテロ環基はハロゲン原子又はC₁₋₆アルキル基で置換されてもよい)で置換されていてもよい)、

(2) アリール基

(当該アリール基は

- 15 (a) C₁₋₄アルキル基又はC₁₋₄アルキルカルボニル基で置換されてもよいヘテロ環基、

(b) 水酸基、オキソ基、ハロゲン原子又はC₁₋₆アルキル基で置換されてもよいC₃₋₇シクロアルキル基、

(c) カルボキシ基、

- 20 (d) ハロゲン原子、

(e) C₁₋₈アルキル基、

(f) C₁₋₄ハロアルキル基、

(g) C₁₋₄アルキルアミノ基、

(h) ジ(C₁₋₄アルキル)アミノ基、

- 25 (i) C₁₋₆アルキルチオ基、

(j) C₁₋₄アルコキシ基

(k) C₁₋₄アルキルカルボニル基及び

(l) ニトロ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい)、

- 30 (3) 芳香族ヘテロ環基

(当該芳香族ヘテロ環基は

(a) C₁₋₄アルキル基又はC₁₋₄アルキルカルボニル基で置換されてもよい

ヘテロ環基、

(b) 水酸基、オキソ基、ハロゲン原子又は C_{1-6} アルキル基で置換されてもよい C_{3-7} シクロアルキル基、

(c) カルボキシ基、

5 (d) ハロゲン原子、

(e) C_{1-8} アルキル基、

(f) C_{1-4} ハロアルキル基、

(g) C_{1-4} アルキルアミノ基、

(h) ジ (C_{1-4} アルキル) アミノ基、

10 (i) C_{1-6} アルキルチオ基、

(j) C_{1-4} アルコキシ基、

(k) C_{1-4} アルキルカルボニル基及び

(l) ハロゲン原子又は C_{1-4} ハロアルキル基で置換されてもよいアリール基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい)、

15 (4) インダニル基又は

(5) ピペラジニル基

(当該ピペラジニル基は

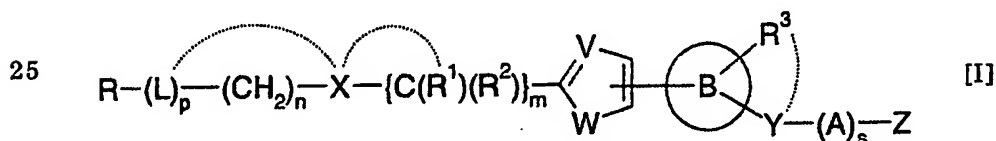
(a) フェニル基、

(b) フェニル C_{1-4} アルキル基、

20 (c) ハロゲン原子で置換されてもよいベンゾイル基及び

(d) フェニル C_{1-4} アルコキシカルボニル基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい) を示す] で示される複素芳香 5 員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩。

[2] 一般式 [I]



[式中、

V は $=N-$ 又は $=CH-$ を示し；

W は $-S-$ 又は $-O-$ を示し；

m は 0、1 又は 2 を示し；

R^1 及び R^2 は、それぞれ独立して、水素原子又は C_{1-4} アルキル基を示し；

X は $-N(R^4)-$ 、 $-N(R^5)-CO-O-$ 、 $-SO_2-N(R^5)-$ 、
 $-N(R^5)-SO_2-$ 、 $-N(R^6)-SO_2-N(R^5)-$ 、 $-CO-N$
 5 $(R^7)-$ 、 $-N(R^8)-CO-$ 、 $-N(R^9)-CO-N(R^5)-$ 、 $-N(R^{10})-(CH_2)_k-N(R^5)-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 又は $-SO_2-$
 (式中、

k は 0 又は 1 乃至 4 の整数を示し、

R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 及び R^{10} は、それぞれ独立して、

10 (1) 水素原子、

(2) C_{1-6} アルキル基

(当該 C_{1-6} アルキル基は

(a) 置換されてもよいアリール基、

(b) 置換されてもよい芳香族ヘテロ環基、

15 (c) カルボキシ基、

(d) C_{1-4} アルコキシカルボニル基、

(e) $-CO-N(R^{15})(R^{16})$

(式中、 R^{15} 及び R^{16} は、それぞれ独立して、水素原子、置換されてもよいアリール基、置換されてもよい芳香族ヘテロ環基、 C_{1-6} アルキル基

20 (当該 C_{1-6} アルキル基は置換されてもよいアリール基、置換されてもよい芳香族ヘテロ環基、アリール基で置換されてもよい C_{1-4} アルコキシ基及び置換されてもよいアリールオキシ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい) を示すか、又はそれらが結合する窒素原子と一緒にあって、インドリン環を形成してもよく、若しくはさらに窒素
 25 原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択される少なくとも 1 つのヘテロ原子を含有してもよい 5 乃至 7 員ヘテロ環を形成してもよい)、

(f) $-N(R^{15})(R^{16})$

(式中、 R^{15} 及び R^{16} は前記記載の通りである)、

(g) $-O-R^{17}$

30 (式中、 R^{17} は水素原子、置換されてもよいアリール基、置換されてもよい芳香族ヘテロ環基又は C_{1-6} アルキル基 (当該 C_{1-6} アルキル基は置換されてもよいアリール基、置換されてもよい芳香族ヘテロ環基、アリール

基で置換されてもよい C_{1-4} アルコキシ基及び置換されてもよいアリールオキシ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい)を示す)、

(h) $-CO-R^{17}$

5 (式中、 R^{17} は前記記載の通りである)、

(i) $-SO_2-R^{17}$

(式中、 R^{17} は前記記載の通りである)又は

(j) C_{3-7} シクロアルキル基で置換されていてもよい)、

(3) $-CO-N(R^{15})(R^{16})$

10 (式中、 R^{15} 及び R^{16} は前記記載の通りである)、

(4) $-SO_2-N(R^{15})(R^{16})$

(式中、 R^{15} 及び R^{16} は前記記載の通りである)、

(5) $-CO-R^{17}$

(式中、 R^{17} は前記記載の通りである)、

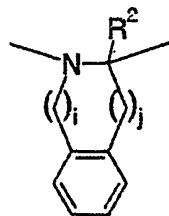
15 (6) $-SO_2-R^{17}$

(式中、 R^{17} は前記記載の通りである)、

(7) 置換されてもよいアリール基、

(8) 置換されてもよい芳香族ヘテロ環基を示すか、又は

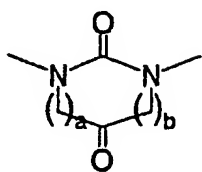
(9) R^4 及び R^1 が一緒になって



20

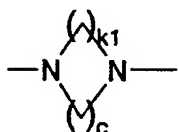
(式中、 i 及び j は、それぞれ独立して、0、1又は2を示し、 R^2 は前記記載の通りである)を形成してもよく、

(10) R^5 及び R^9 が一緒になって



(式中、a 及び b は、それぞれ独立して、0、1 又は 2 を示す) を形成してもよく、

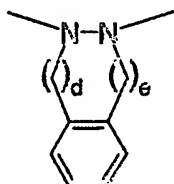
(11) R^5 及び R^{10} が一緒になって



5

(式中、k1 及び c は、それぞれ独立して、0 又は 1 乃至 4 の整数を示す) を形成してもよく、若しくは

(12) R^5 及び R^{10} が一緒になって



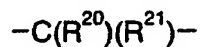
10 (式中、d 及び e は、それぞれ独立して、0、1 又は 2 を示す) を形成してもよい) を示し；

n は 0 又は 1 乃至 4 の整数を示し；

p は 0 又は 1 を示し；

L は

15 (1)



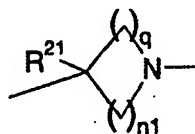
(式中、

R^{20} は

(a) 水素原子、

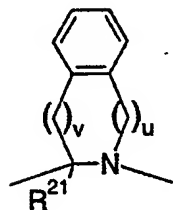
20 (b) C_{1-6} アルキル基を示すが、又は

(c) R^4 と一緒になって



(式中、 $n1$ 及び q は、それぞれ独立して、0 又は 1 乃至 4 の整数を示す) を形成してもよく、若しくは

5 (d) R^4 と一緒になって

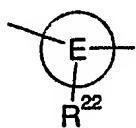


(式中、 u 及び v は、それぞれ独立して、0、1 又は 2 を示す) を形成してもよく、

R^{21} は水素原子、 C_{1-6} アルキル基 (当該 C_{1-6} アルキル基は置換されてもよいアリール基又は置換されてもよい芳香族ヘテロ環基で置換されていてもよい)、置換されてもよいアリール基又は置換されてもよい芳香族ヘテロ環基を示す)、

10

(2)



15. (式中、

E はアリール基又は芳香族ヘテロ環基を示し、

R^{22} は

(a) 水素原子、

(b) ハロゲン原子、

20

(c) C_{1-4} アルキル基、

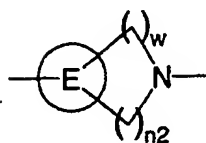
(d) カルボキシ基で置換されてもよい C_{1-4} アルコキシ基、

(e) C_{1-6} アルキルチオ基、

(f) ニトロ基、

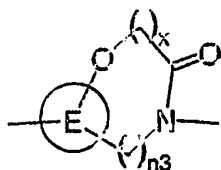
(g) $-N(R^{23})(R^{24})$

- (式中、 R^{23} 及び R^{24} は、それぞれ独立して、水素原子、 C_{1-6} アルキル基、 C_{1-4} アルキルカルボニル基 (当該 C_{1-4} アルキルカルボニル基はアミノ基、
 5 C_{1-4} アルキルアミノ基又はジ (C_{1-4} アルキル) アミノ基で置換されている) 又は C_{1-4} アルキルスルホニル基を示す) を示すか、又は
 (h) R^4 と一緒になって



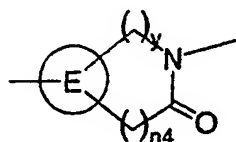
- (式中、 n_2 及び w は、それぞれ独立して、0 又は 1 乃至 3 の整数を示し、
 10 E は前記記載の通りである) を形成してもよく、

(i) R^4 と一緒になって



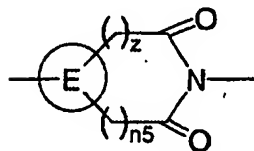
(式中、 n_3 及び x は、それぞれ独立して、0 又は 1 を示し、E は前記記載の通りである) を形成してもよく、

- 15 (j) R^7 と一緒になって



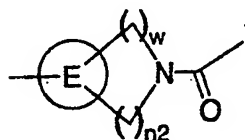
(式中、 n_4 及び y は、それぞれ独立して、0、1 又は 2 を示し、E は前記記載の通りである) を形成してもよく、

(k) R^7 と一緒になって



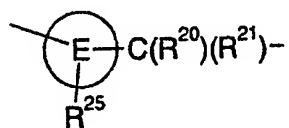
(式中、 n_5 及び z は、それぞれ独立して、0 又は 1 を示し、E は前記記載の通りである) を形成してもよく、若しくは

(1) R^8 と一緒になって



5 (式中、 n_2 及び w は、それぞれ独立して、0 又は 1 乃至 3 の整数を示し、E は前記記載の通りである) を形成してもよい) 又は

(3)



(式中、

10 R^{20} 、 R^{21} 及び E は前記記載の通りであり、
 R^{25} は

(a) 水素原子、

(b) ハロゲン原子、

(c) C_{1-4} アルキル基、

15 (d) カルボキシ基で置換されてもよい C_{1-4} アルコキシ基、

(e) C_{1-6} アルキルチオ基、

(f) ニトロ基又は

(g) $-N(R^{23})(R^{24})$

(式中、 R^{23} 及び R^{24} は前記記載の通りである) を示し；

20 R は $-COO(R^{19})$ 、 $-A^1-COO(R^{19})$ 又は $-O-A^1-COO(R^{19})$

(式中、 A^1 は C_{1-4} アルキレン基を示し、 R^{19} は水素原子又は C_{1-4} アルキル基を示す) を示し；

B はアリール基又は芳香族ヘテロ環基を示し；

25 R^3 は

(1) 水素原子、

- (2) ハロゲン原子、
- (3) C_{1-8} アルキル基、
- (4) C_{1-6} アルコキシ基、
- (5) C_{1-6} アルキルアミノ基、
- 5 (6) ジ (C_{1-6} アルキル) アミノ基、
- (7) シアノ基、
- (8) ニトロ基、
- (9) C_{1-4} ハロアルキル基、
- (10) $-S-R^{18}$ (R^{18} は C_{1-6} アルキル基又はアリール基を示す)、
- 10 (11) $-SO-R^{18}$ (R^{18} は C_{1-6} アルキル基又はアリール基を示す) 又は
- (12) $-SO_2-R^{18}$ (R^{18} は C_{1-6} アルキル基又はアリール基を示す) を示し;

Y は $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-N(R^{11})-$ 、 $-N(R^{12})-$ 、 $-CO-$ 、 $-N(R^{12})-SO_2-$ 、 $-SO_2-N(R^{12})-$ 、 $-C(R^{13})(R^{14})-$ 、 $-CO-$ 、 $-C(R^{13})(R^{14})-N(R^{12})-$ 、 $-CO-N(R^{12})-$ 又は $-C(R^{13})(R^{14})-O-$

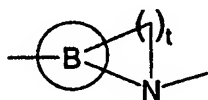
(式中、

R^{11} は

- (1) 水素原子、
- 20 (2) C_{1-8} アルキル基
- (当該 C_{1-8} アルキル基は
- (a) C_{3-7} シクロアルキル基、
- (b) 置換されてもよいアリール基、
- (c) 置換されてもよいヘテロ環基、
- 25 (d) 水酸基、
- (e) C_{1-4} アルキルアミノ基及び
- (f) ジ (C_{1-4} アルキル) アミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい)、
- (3) C_{2-4} アルケニル基、
- 30 (4) C_{1-4} アルキルスルホニル基、
- (5) C_{1-4} アルキルカルボニル基
- (当該 C_{1-4} アルキルカルボニル基は水酸基又は C_{1-4} アルコキシ基で置換

されていてもよい)を示すか、又は

(6) R^3 と一緒にあって



(式中、 t は1乃至4の整数を示し、 B は前記記載の通りである)を形

5 成してもよく、

R^{12} は

(1)水素原子、

(2) C_{1-8} アルキル基

(当該 C_{1-8} アルキル基は

10 (a) C_{3-7} シクロアルキル基、

(b)置換されてもよいアリール基、

(c)置換されてもよいヘテロ環基、

(d)水酸基、

(e) C_{1-4} アルキルアミノ基及び

15 (f)ジ (C_{1-4} アルキル) アミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい)、

(3) C_{2-4} アルケニル基、

(4) C_{1-4} アルキルスルホニル基又は

(5) C_{1-4} アルキルカルボニル基

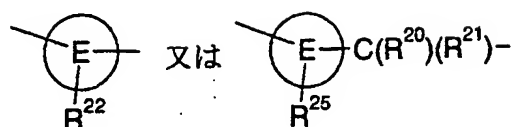
20 (当該 C_{1-4} アルキルカルボニル基は水酸基又は C_{1-4} アルコキシ基で置換されていてもよい)を示し、

R^{13} 及び R^{14} は、それぞれ独立して、水素原子、 C_{1-4} アルキル基を示すか、又はそれらが結合する炭素原子と一緒にあって C_{3-7} シクロアルカンを形成してもよく、若しくはそれらが結合する炭素原子と一緒にあって、さ

25 らに窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択される少なくとも1つのヘテロ原子を含有してもよい5乃至7員ヘテロ環を形成してもよい)を示し

(但し、

m が0であり、 p が1であり、 L が



- (式中、 R^{20} 及び R^{21} はそれぞれ水素原子を示し、 E はフェニル基を示し、 R^{22} は水素原子、ハロゲン原子、 C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基又はニトロ基を示し、 R^{25} は水素原子、ハロゲン原子、 C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基又はニトロ基を示す) である場合には、

Y は、

$-C(R^{13})(R^{14})-N(R^{12})-$ 、 $-CO-N(R^{12})-$ 又は $-C(R^{13})(R^{14})-O-$ (式中、 R^{12} 、 R^{13} 及び R^{14} は前記記載の通りである) である)；

- 10 s は 0 又は 1 を示し；

A は C_{3-7} シクロアルキル基で置換されてもよい C_{1-4} アルキレン基を示し；

Z は

(1) C_{3-7} シクロアルキル基

- 15 (当該 C_{3-7} シクロアルキル基はアリール基 (当該アリール基はハロゲン原子又は C_{1-6} アルキル基で置換されてもよい) 又は芳香族ヘテロ環基 (当該芳香族ヘテロ環基はハロゲン原子又は C_{1-6} アルキル基で置換されてもよい) で置換されていてもよい)、

(2) アリール基

- 20 (当該アリール基は

(a) C_{1-4} アルキル基又は C_{1-4} アルキルカルボニル基で置換されてもよいヘテロ環基、

(b) 水酸基、オキソ基、ハロゲン原子又は C_{1-6} アルキル基で置換されてもよい C_{3-7} シクロアルキル基、

- 25 (c) カルボキシ基、

(d) ハロゲン原子、

(e) C_{1-8} アルキル基、

(f) C_{1-4} ハロアルキル基、

(g) C_{1-4} アルキルアミノ基、

- (h) ジ (C_{1-4} アルキル) アミノ基、
(i) C_{1-6} アルキルチオ基、
(j) C_{1-4} アルコキシ基及び
(k) C_{1-4} アルキルカルボニル基からなる群より選択される置換基で置換
5 されていてもよい)、
(3) 芳香族ヘテロ環基
(当該芳香族ヘテロ環基は
(a) C_{1-4} アルキル基又は C_{1-4} アルキルカルボニル基で置換されてもよい
ヘテロ環基、
10 (b) 水酸基、オキシ基、ハロゲン原子又は C_{1-6} アルキル基で置換されて
もよい C_{3-7} シクロアルキル基、
(c) カルボキシ基、
(d) ハロゲン原子、
(e) C_{1-8} アルキル基、
15 (f) C_{1-4} ハロアルキル基、
(g) C_{1-4} アルキルアミノ基、
(h) ジ (C_{1-4} アルキル) アミノ基、
(i) C_{1-6} アルキルチオ基、
(j) C_{1-4} アルコキシ基、
20 (k) C_{1-4} アルキルカルボニル基及び
(l) ハロゲン原子又は C_{1-4} ハロアルキル基で置換されてもよいアリール
基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい)、
(4) インダニル基又は
(5) ピペラジニル基
25 (当該ピペラジニル基は
(a) フェニル基、
(b) フェニル C_{1-4} アルキル基、
(c) ハロゲン原子で置換されてもよいベンゾイル基及び
(d) フェニル C_{1-4} アルコキシカルボニル基からなる群より選択される置
30 換基で置換されていてもよい) を示す] で示される上記 [1] 記載の複
素芳香 5 員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許
容し得る塩。

[3] 一般式 [I] において、

R^3 は

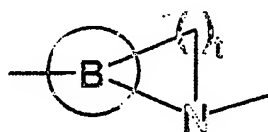
- (1) 水素原子、
- (2) ハロゲン原子、
- 5 (3) C_{1-6} アルキル基又は
- (4) C_{1-4} アルコキシ基を示し；

Y は $-O-$ 、 $-N(R^{11})-$ 、 $-N(R^{12})-CO-$ 、 $-C(R^{13})(R^{14})-$ 、 $-C(R^{13})(R^{14})-N(R^{12})-$ 、 $-CO-N(R^{12})-$ 又は $-C(R^{13})(R^{14})-O-$

10 (式中、

R^{11} は

- (1) 水素原子、
- (2) C_{1-8} アルキル基を示すか、又は
- (3) R^3 と一緒になって



15

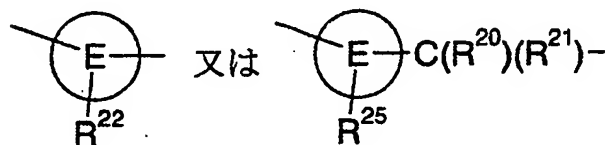
(式中、 t は 3 を示し、 B は上記 [2] 記載の通りである) を形成してもよく、

R^{12} は水素原子又は C_{1-8} アルキル基を示し、

R^{13} 及び R^{14} はそれぞれ水素原子を示す) を示し

20 (但し、

m が 0 であり、 p が 1 であり、 L が



(式中、 R^{20} 及び R^{21} はそれぞれ水素原子を示し、 E はフェニル基を示し、 R^{22} は水素原子、 C_{1-4} アルコキシ基又はニトロ基を示し、 R^{25} は水素原子、

25 C_{1-4} アルコキシ基又はニトロ基を示す) である場合には、

Yは、

—C(R¹³)(R¹⁴)—N(R¹²)—、—CO—N(R¹²)—又は—C(R¹³)(R¹⁴)—O—(式中、R¹²、R¹³及びR¹⁴は前記記載の通りである)を示す)；

5 sは0又は1を示し；

AはC₁₋₄アルキレン基を示し；

Zは

(a)ハロゲン原子及びC₁₋₆アルキル基からなる群より選択される1乃至3の置換基で置換されてもよいC₃₋₇シクロアルキル基、

10 (b)ハロゲン原子、

(c)C₁₋₈アルキル基、

(d)C₁₋₄ハロアルキル基、

(e)ジ(C₁₋₄アルキル)アミノ基、

(f)C₁₋₆アルキルチオ基及び

15 (g)C₁₋₄アルキルカルボニル基

からなる群より選択される置換基で置換されたアリール基を示す上記[1]記載の複素芳香5員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩。

[4] Vが=N—であり且つWが—S—若しくは—O—であるか、又はVが=CH—であり且つWが—S—である上記[3]記載の複素芳香5員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩。

[5] ZがC₁₋₃アルキル基で置換されたフェニル基である上記[4]記載の複素芳香5員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの25 医薬上許容し得る塩。

[6] Yが—C(R¹³)(R¹⁴)—N(R¹²)—若しくは—C(R¹³)(R¹⁴)—O—(式中、R¹²、R¹³及びR¹⁴は上記[3]に記載の通りである)であり且つsが0であるか、又はYが—O—若しくは—N(R¹¹)—(式中、R¹¹は上記[3]に記載の通りである)であり且つsが1であり、A30 がメチレン基である上記[5]記載の複素芳香5員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩。

[7] Vが=CH—であり、Wが—S—であり、且つ前記のV及びW

が構成するチオフェン環上におけるBの置換位置が4位又は5位である
上記〔6〕記載の複素芳香5員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又は
はそれらの医薬上許容し得る塩。

〔8〕 Bがフェニル基である上記〔7〕記載の複素芳香5員環化合物
5 若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩。

〔9〕 mが1であり；

R¹及びR²がそれぞれ水素原子であり；

Xが-N(R⁴)-又は-O-

(式中、R⁴は

10 (a)アリール基、

(b) 1乃至3個のC₁₋₈アルキル基で置換されてもよい芳香族ヘテロ環基
又は

(c)-CO-N(R¹⁵)(R¹⁶)

(式中、R¹⁵及びR¹⁶は、それぞれ独立して、水素原子又はアリール基

15 (当該アリール基は1乃至3個のC₁₋₃アルキル基で置換されていてもよい)
を示す)

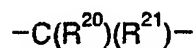
で置換されていてもよいC₁₋₆アルキル基を示す)であり；

nが0又は1であり；

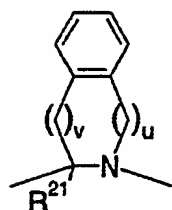
pが0又は1であり；

20 Lが

(1)

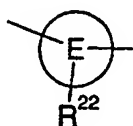


(式中、R²⁰はR⁴と一緒にあって



25 (式中、uは1を示し、vは1を示し、R²は前記記載の通りである)を
形成し、

R²¹は水素原子を示す) 又は
(2)



- (式中、Eは芳香族ヘテロ環基を示し、R²²は水素原子を示す) であり；
- 5 Rが-COO (R¹⁹)
- (式中、R¹⁹は水素原子を示す) である上記〔8〕記載の複素芳香5員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩。
- 〔10〕 Xが-N (R⁴) (式中、R⁴は上記〔9〕に記載の通りである) であり、nが1であり、pが0である上記〔9〕記載の複素芳香5
- 10 員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩。
- 〔11〕 R⁴が1個のC₁₋₈アルキル基で置換されてもよい芳香族ヘテロ環基で置換されたメチル基である上記〔10〕記載の複素芳香5員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩。
- 15 〔12〕 上記〔11〕記載の芳香族ヘテロ環がチアゾリル基、オキサゾリル基又はベンズイミダゾリル基である上記〔11〕記載の複素芳香5員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩。
- 〔13〕 R⁴が-CO-N (R¹⁵) (R¹⁶) (式中、R¹⁵は水素原子を示し、
- 20 R¹⁶は1個のC₁₋₈アルキル基で置換されてもよいアリール基を示す) で置換されたメチル基である上記〔10〕記載の複素芳香5員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩。
- 〔14〕 Vが=N-であり、Wが-S-であり、且つ前記のV及びWが構成するチアゾール環上におけるBの置換位置が4位である上記
- 25 〔6〕記載の複素芳香5員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩。
- 〔15〕 Bがフェニル基である上記〔14〕記載の複素芳香5員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩。
- 〔16〕 mが0又は1であり；

R^1 及び R^2 が、それぞれ独立して、水素原子又は C_{1-4} アルキル基であり；

X が $-N(R^4)-$ 、 $-N(R^5)-CO-O-$ 、 $-SO_2-N(R^5)-$ 、
 $-CO-N(R^7)-$ 、 $-N(R^9)-CO-N(R^5)-$ 、 $-N(R^{10})-$
 5 $(CH_2)_k-N(R^5)-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 又は $-SO_2-$
 (式中、

R^4 は

(1) 水素原子、

(2) C_{1-8} アルキル基

10 (当該 C_{1-6} アルキル基は

(a) ハロゲン原子、 C_{1-8} アルキル基及び C_{1-4} ハロアルキル基からなる群より選択される 1 乃至 3 個の置換基で置換されてもよいアリール基、

(b) 1 乃至 3 個の C_{1-8} アルキル基で置換されてもよい芳香族ヘテロ環基、

(c) カルボキシ基、

15 (d) C_{1-4} アルコキシカルボニル基、

(e) $-CO-N(R^{15})(R^{16})$

(式中、 R^{15} 及び R^{16} は、それぞれ独立して、水素原子、アリール基 (当該アリール基は C_{1-8} アルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、カルボキシ基及びジ (C_{1-4} アルキル) アミノ基からなる群より選択される 1 乃至 3 個の置
 20 換基で置換されていてもよい)、芳香族ヘテロ環基、 C_{1-6} アルキル基 (当該 C_{1-6} アルキル基はアリール基で置換されていてもよい) を示すか、又はそれらが結合する窒素原子と一緒に、さらに窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択される少なくとも 1 つのヘテロ原子を含有してもよい 5 乃至 7 員ヘテロ環を形成してもよい)、

25 (f) $-N(R^{15})(R^{16})$

(式中、 R^{15} 及び R^{16} は、それぞれ独立して、水素原子又はアリール基を示す)、

(g) $-O-R^{17}$

(式中、 R^{17} はアリール基を示す) 又は

30 (h) C_{3-7} シクロアルキル基で置換されていてもよい)、

(3) $-CO-N(R^{15})(R^{16})$

(式中、 R^{15} 及び R^{16} は、それぞれ独立して、水素原子、アリール基 (当

- 該アリール基は1乃至3個の C_{1-8} アルキル基で置換されていてもよい)、
 C_{1-6} アルキル基を示すか、又はそれらが結合する窒素原子と一緒になっ
 て、インドリン環を形成してもよく、若しくはさらに窒素原子、酸素原子
 及び硫黄原子からなる群より選択される少なくとも1つのヘテロ原子
 5 を含有してもよい5乃至7員ヘテロ環を形成してもよい)、



(式中、 R^{15} 及び R^{16} は、それぞれ独立して、アリール基又は C_{1-6} アルキル基を示す)、



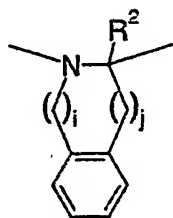
- 10 (式中、 R^{17} はアリール基(当該アリール基は C_{1-8} アルキル基及び C_{1-4} アルコキシ基からなる群より選択される1乃至3個の置換基で置換されていてもよい)、芳香族ヘテロ環基又は C_{1-6} アルキル基(当該 C_{1-6} アルキル基は、ハロゲン原子及び C_{1-8} アルキル基から選択される1乃至3個の置換基で置換されてもよいアリール基、芳香族ヘテロ環基、アリール基
 15 で置換されてもよい C_{1-4} アルコキシ基又は1乃至3個の C_{1-8} アルキル基で置換されてもよいアリールオキシ基で置換されていてもよい)を示す)、



(式中、 R^{17} はアリール基を示す)、

(7)アリール基を示すか、又は

- 20 (8) R^1 と一緒に



(式中、 i 及び j はそれぞれ1を示し、 R^2 は前記記載の通りである)を形成してもよく、

- R^5 は水素原子又はアリール基若しくは C_{3-7} シクロアルキル基で置換されていてもよい C_{1-6} アルキル基を示し、
 25

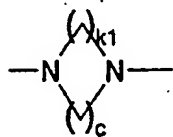
R^7 は水素原子又は C_{1-6} アルキル基を示し、

R^9 は水素原子又は C_{1-6} アルキル基を示し、

k は2を示し、

R^{10} は

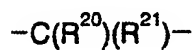
- (1) 水素原子、
- (2) C_{1-6} アルキル基を示すか、又は
- (3) R^5 と一緒になって



5

(式中、 k_1 及び c はそれぞれ 2 を示す) を形成してもよい) であり ;
 n が 0 又は 1 乃至 3 の整数であり ;
 p が 0 又は 1 であり ;
 L が

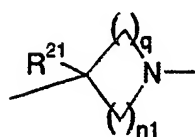
10 (1)



(式中、

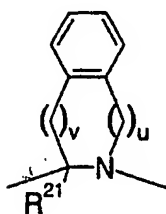
R^{20} は

- (a) 水素原子、
- 15 (b) C_{1-6} アルキル基を示すか、又は
- (c) R^4 と一緒になって



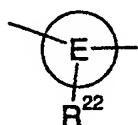
(式中、 n_1 及び q は、それぞれ独立して、1 乃至 3 の整数を示す) を形成してもよく、若しくは

20 (d) R^4 と一緒になって



(式中、u は 1 を示し、v は 1 を示す) を形成してもよく、
 R^{21} は水素原子、 C_{1-6} アルキル基 (当該 C_{1-6} アルキル基は 1 乃至 3 個のハロゲン原子で置換されてもよいアリール基で置換されていてもよい) 又はアリール基を示す) 又は、

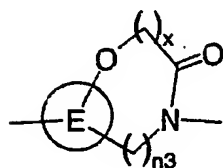
5 (2)



(式中、
 E はアリール基又は芳香族ヘテロ環基を示し、
 R^{22} は

- 10 (a) 水素原子、
 (b) カルボキシ基で置換されてもよい C_{1-4} アルコキシ基、
 (c) ニトロ基、
 (d) $-N(R^{23})(R^{24})$

(式中、 R^{23} 及び R^{24} は、それぞれ独立して、水素原子、 C_{1-4} アルキルカルボニル基 (当該 C_{1-4} アルキルカルボニル基は C_{1-4} アルキルアミノ基又はジ (C_{1-4} アルキル) アミノ基で置換されていてもよい) 又は C_{1-4} アルキルスルホニル基を示す) を示すか、又は
 15 (e) R^4 と一緒になって



20 (式中、 $n3$ は 0 を示し、 x は 1 を示し、E は前記記載の通りである) を形成してもよい) であり；

R が $-COO(R^{19})$

(式中、 R^{19} は水素原子又は C_{1-4} アルキル基を示す) である上記 [15] 記載の複素芳香 5 員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの

25 医薬上許容し得る塩。

[17] m が 1 であり、 R^1 及び R^2 がそれぞれ水素原子である上記

[16] 記載の複素芳香 5 員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩。

[18] X が $-N(R^4)$ (式中、 R^4 は上記 [16] に記載の通りである) であり、n が 1 であり、p が 0 である上記 [17] 記載の複素芳香 5 員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩。

[19] R^4 が

(a) ハロゲン原子、 C_{1-8} アルキル基及び C_{1-4} ハロアルキル基からなる群より選択される 1 乃至 3 個の置換基で置換されてもよいアリール基、

10 (b) 1 乃至 3 個の C_{1-8} アルキル基で置換されてもよい芳香族ヘテロ環基、
(c) カルボキシ基、

(d) C_{1-4} アルコキシカルボニル基、

(e) $-CO-N(R^{15})(R^{16})$

(式中、 R^{15} 及び R^{16} は、それぞれ独立して、水素原子、アリール基 (当該アリール基は C_{1-8} アルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、カルボキシ基及びジ (C_{1-4} アルキル) アミノ基からなる群より選択される 1 乃至 3 個の置換基で置換されていてもよい)、芳香族ヘテロ環基、 C_{1-6} アルキル基 (当該 C_{1-6} アルキル基はアリール基で置換されていてもよい) を示すか、又はそれらが結合する窒素原子と一緒に、さらに窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択される少なくとも 1 つのヘテロ原子を含有してもよい 5 乃至 7 員ヘテロ環を形成してもよい)、

20 (f) $-N(R^{15})(R^{16})$

(式中、 R^{15} 及び R^{16} は、それぞれ独立して、水素原子又はアリール基を示す)、

25 (g) $-O-R^{17}$

(式中、 R^{17} はアリール基を示す) 又は

(h) C_{3-7} シクロアルキル基

で置換されていてもよい C_{1-6} アルキル基である上記 [18] 記載の複素芳香 5 員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩。

30 [20] R^4 が 1 個の C_{1-8} アルキル基で置換されてもよい芳香族ヘテロ環基で置換されたメチル基である上記 [19] 記載の複素芳香 5 員環化

合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩。

- [21] 上記[20]記載の芳香族ヘテロ環がチアゾリル基、オキサゾリル基、ベンズイミダゾリル基、ピリジル基又はキノリル基である上記[20]記載の複素芳香5員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩。

[22] R^4 が $-CO-N(R^{15})(R^{16})$ (式中、 R^{15} は水素原子を示し、 R^{16} は1個の C_{1-8} アルキル基で置換されてもよいアリール基を示す) で置換されたメチル基である上記[19]記載の複素芳香5員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩。

- 10 [23] 以下の化合物からなる群より選択される上記[1]乃至[22]のいずれかに記載の複素芳香5員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩。

(1) 5-{4-[4-({4-(1-エチル-プロピル)-フェニル}-イソプロピル-アミノ)-メチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメトキシ}-ニコチン酸、

- 15 (2) 4-{4-[4-({4-(1-エチル-プロピル)-フェニル}-イソプロピル-アミノ)-メチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメトキシ}-安息香酸、

(3) 6-{4-[4-({4-(1-エチル-プロピル)-フェニル}-イソプロピル-アミノ)-メチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメトキシ}-ニコチン酸、

- (4) 5-{4-[4-({メチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ)-メチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメトキシ}-ニコチン酸、

(5) 4-{4-[4-({メチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ)-メチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメトキシ}-安息香酸、

(6) 6-[4-(4-{{4-(イソプロピル-フェニル)-(1-プロピル-ブチル)-アミノ}-メチル}-フェニル)-チアゾール-2-イルメトキシ]-ニコチン酸、

- 25 (7) 5-[4-(4-{{4-(イソプロピル-フェニル)-(1-プロピル-ブチル)-アミノ}-メチル}-フェニル)-チアゾール-2-イルメトキシ]-ニコチン酸、

(8) 5-[4-(4-{{イソブチル-(4-イソプロピル-フェニル)-アミノ}-メチル}-フェニル)-チアゾール-2-イルメトキシ]-ニコチン酸、

- (9) 4-[4-(4-{{4-(イソプロピル-フェニル)-(1-プロピル-ブチル)-アミノ}-メチル}-フェニル)-チアゾール-2-イルメトキシ]-安息香酸、

(10) 3-[4-(4-{{4-(イソプロピル-フェニル)-(1-プロピル-ブチル)-アミノ}-メチル}-フェニル)-チアゾール-2-イルメトキシ]-安息香酸、

- (11) 6-[4-(4-[(1-エチル-プロピル)-(4-イソプロピル-フェニル)-アミノ]-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメトキシ]-ニコチン酸、
- (12) 5-[4-(4-[(1-エチル-プロピル)-(4-イソプロピル-フェニル)-アミノ]-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメトキシ]-ニコチン酸、
- 5 (13) 4-[4-[4-([4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ)-メチル]-フェニル]-チアゾール-2-イルメチルチオ}-安息香酸、
- (14) 4-[4-[4-([メチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ)-メチル]-フェニル]-チアゾール-2-イルメチルチオ}-安息香酸、
- (15) 4-(メチル-[4-[4-([メチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ)-メチル]-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル)-スルファモイル)-安息香酸、
- 10 (16) 4-(メチル-[4-[4-([メチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ)-メチル]-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル)-スルファモイル)-酪酸ナトリウム、
- 15 (17) 4-([4-[4-[(4-シクロヘキシル-フェニルアミノ)-メチル]-フェニル]-チアゾール-2-イル)-メチル-アミノ]-メチル)-安息香酸、
- (18) 4-([4-[4-[(4-シクロヘキシル-フェニル)-メチル-アミノ]-メチル]-フェニル]-チアゾール-2-イル)-メチル-アミノ)-メチル)-安息香酸、
- (19) 4-([メチル-[4-[4-([メチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ)-メチル]-フェニル]-チアゾール-2-イル)-アミノ)-メチル]-安息香酸、
- 20 (20) 4-([4-[4-([4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ)-メチル]-フェニル]-チアゾール-2-イル)-メチル-アミノ)-メチル]-安息香酸、
- 25 (21) (S)-([4-[4-([4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ)-メチル]-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル)-メチル-アミノ)-フェニル-酢酸、
- (22) (S)-2-([4-[4-([4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ)-メチル]-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル)-メチル-アミノ)-3-フェニル-プロピオン酸、
- 30 (23) {ベンジル-[4-(4-[(4-tert-ブチル-フェニル)-イソブチル-アミノ]-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ}-酢酸、

- (24) {ベンジル-[4-(4-{[(4-クロロ-フェニル)-イソブチル-アミノ]-メチル}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ}-酢酸、
- (25) (ベンジル-{4-[4-({メチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ)-メチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ}-酢酸、
- 5 (26) (ベンジル-{4-[4-({[4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ)-メチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ}-酢酸、
- (27) {1-[4-(4-{[(4-tert-ブチル-フェニル)-イソブチル-アミノ]-メチル}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-3-フェニル-ウレイド}-酢酸、
- 10 (28) {ベンゾイル-[4-(4-{[(4-tert-ブチル-フェニル)-イソブチル-アミノ]-メチル}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ}-酢酸、
- (29) [[4-(4-{[(4-tert-ブチル-フェニル)-イソブチル-アミノ]-メチル}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-(ピリジン-2-イルカルボニル)-アミノ]-酢酸、
- 15 (30) [[4-(4-{[(4-tert-ブチル-フェニル)-イソブチル-アミノ]-メチル}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-(ピリジン-3-イルカルボニル)-アミノ]-酢酸、
- (31) {ベンゼンスルホニル-[4-(4-{[(4-tert-ブチル-フェニル)-イソブチル-アミノ]-メチル}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ}-酢酸、
- 20 酸、
- (32) 2-{4-[4-({[4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ)-メチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル}-1,2,3,4-テトラヒドロ-イソキノリン-3-カルボン酸、
- (33) (S)-2-{4-[4-({[4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ)-メチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル}-1,2,3,4-テトラヒドロ-イソキノリン-3-カルボン酸、
- 25 (34) (S)-2-{4-[4-({メチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ)-メチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル}-1,2,3,4-テトラヒドロ-イソキノリン-3-カルボン酸、
- (35) (S)-2-[4-(4-{[(1-エチル-プロピル)-(4-イソプロピル-フェニル)-アミノ]-メチル}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-1,2,3,4-テトラヒドロ-イソキノリン-3-カルボン酸、
- 30

- (36) 4-({4-[4-(4-シクロヘキシル-フェノキシメチル)-フェニル]-チアゾール-2-イル}-メチル-アミノ)-安息香酸、
- (37) 4-[(4-[4-(4-シクロヘキシル-フェノキシメチル)-フェニル]-チアゾール-2-イル)-メチル-アミノ)-メチル]-安息香酸、
- 5 (38) 4-[(4-[4-(4-(1,1-ジメチル-プロピル)-フェノキシメチル]-フェニル)-チアゾール-2-イル)-メチル-アミノ]-メチル)-安息香酸、
- (39) 4-[(メチル-(4-[4-(4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル)-チアゾール-2-イル)-アミノ]-メチル)-安息香酸、
- (40) 4-[(メチル-(4-[4-(4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル)-チアゾール-2-イル)-アミノ]-メチル)-安息香酸ナトリウム、
- 10 (41) (S)-[メチル-(4-[4-(4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-フェニル-酢酸、
- (42) (S)-2-[メチル-(4-[4-(4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-3-フェニル-プロピオン酸、
- 15 (43) (ベンジル-(4-[4-(2-tert-ブチル-4-メチル-フェノキシメチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ)-酢酸、
- (44) [ベンジル-(4-[4-(4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- 20 (45) 2-(4-[4-(4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-1,2,3,4-テトラヒドロ-イソキノリン-3-カルボン酸、
- (46) (S)-2-(4-[4-(4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-1,2,3,4-テトラヒドロ-イソキノリン-3-カルボン酸、
- 25 (47) (R)-2-(4-[4-(4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-1,2,3,4-テトラヒドロ-イソキノリン-3-カルボン酸、
- (48) 5-(4-[4-(4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル)-チアゾール-2-イルメトキシ)-ニコチン酸、
- 30 (49) 4-(4-[4-(4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル)-チアゾール-2-イルメトキシ)-安息香酸、

- (50) 4-[メチル-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-スルファモイル]-安息香酸、
- (51) 4-[メチル-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-スルファモイル]-酪酸、
- 5 (52) 4-((4-[4-(4-シクロヘキシル-フェニルカルバモイル)-フェニル]-チアゾール-2-イル)-メチル-アミノ)-安息香酸、
- (53) 4-[(4-[4-(4-シクロヘキシル-フェニルカルバモイル)-フェニル]-チアゾール-2-イル)-メチル-アミノ)-メチル]-安息香酸、
- (54) [ベンジル-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニルカルバモイル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- 10 (55) [ベンジル-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルカルバモイル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (56) {ベンジル-[4-(4-{メチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-カルバモイル}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ}-酢酸、
- 15 (57) {ベンジル-[4-(4-{エチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-カルバモイル}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ}-酢酸、
- (58) 5-{4-[4-((2-ヒドロキシ-2-メチル-プロピル)-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ)-メチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメトキシ}-ニコチン酸、
- 20 (59) [[4-(4-{(4-tert-ブチル-フェニル)-イソブチル-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル]-(モルホリン-4-カルボニル)-アミノ]-酢酸、
- (60) 5-{4-[4-((4-(1-エチル-プロピル)-フェニル)-イソプロピル-アミノ)-メチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメトキシ}-ニコチン酸ナトリウム、
- 25 (61) (S)-2-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-1,2,3,4-テトラヒドロ-イソキノリン-3-カルボン酸ナトリウム、
- (62) 5-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメトキシ)-ニコチン酸ナトリウム、
- 30 (63) 3-{4-[4-((4-(1-エチル-プロピル)-フェニル)-イソプロピル-アミノ)-メチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメトキシ}-5-メトキシ-安息

香酸、

(64) (1-{4-[4-({[4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-3-フェニル-ウレイド)-酢酸、

5 (65) (1-{4-[4-({[4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-3-p-トリル-ウレイド)-酢酸、

(66) [1-{4-[4-({[4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-3-(4-イソプロピル-フェニル)-ウレイド]-酢酸、

10 (67) (1-{4-[4-({[4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-3-メチル-3-フェニル-ウレイド)-酢酸、

(68) 5-{4-[4-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメトキシ}-ニコチン酸、

(69) [3-フェニル-1-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-ウレイド]-酢酸、

(70) (3-(2,6-ジメチル-フェニル)-1-{4-[4-({[4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-ウレイド)-酢酸、

(71) ({4-[4-({[4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-フェニルカルバモイルメチル-アミノ)-酢酸、

(72) (1-{4-[4-({[4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-3-イソプロピル-ウレイド)-酢酸、

(73) 3-{4-[4-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメトキシ}-イソキサゾール-5-カルボン酸、

30 (74) 5-[4-(4-{[(2-エチル-ブチル)-(4-イソプロピル-フェニル)-アミノ]-メチル}-フェニル)-チアゾール-2-イルメトキシ]-ニコチン酸、

(75) [{4-[4-({[4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミ

ノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル)-(ピペリジン-1-カルボ
ニル)-アミノ]-酢酸、

(76) 2-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-
チアゾール-2-イルメトキシ)-ニコチン酸、

- 5 (77) [{4-[4-({4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミ
ノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-(p-トリルカルバモイ
ル-メチル)-アミノ]-酢酸、

- (78) {4-[4-({4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミ
ノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-[(4-イソプロピル-フ
10 エニルカルバモイル)-メチル]-アミノ]-酢酸、

(79) (1-{4-[4-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-ア
ミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-3-メチル-3-フェニ
ル-ウレイド)-酢酸、

- (80) (1-{4-[4-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-ア
15 ミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-3-p-トリル-ウレイ
ド)-酢酸、

(81) ((2,3-ジヒドロ-インドール-1-カルボニル)-{4-[4-({イソプロピ
ル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ}-メチル)-フェニル]-チア
ゾール-2-イルメチル}-アミノ)-酢酸、

- 20 (82) 3-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-
チアゾール-2-イルメトキシ)-ピリジン-2-カルボン酸、

(83) {4-[4-({(2-エチル-ブチル)-(4-イソプロピル-フェニル)-アミ
ノ]-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル]-フェニルカルバモイル
メチル-アミノ]-酢酸、

- 25 (84) {[4-(4-{{(2-エチル-ブチル)-(4-イソプロピル-フェニル)-アミ
ノ]-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-[(4-イソプロピル-フ
エニルカルバモイル)-メチル]-アミノ]-酢酸、

- (85) 4-(2-{カルボキシメチル-[4-(4-{{(2-エチル-ブチル)-(4-イソ
プロピル-フェニル)-アミノ]-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチ
30 ル}-アミノ)-アセチルアミノ)-安息香酸、

(86) 6-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-
チアゾール-2-イルメトキシ)-ピリジン-2-カルボン酸、

- (87) 5-{4-[4-({イソブチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメトキシ}-ニコチン酸、
- (88) (1-{4-[4-({イソブチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-3-フェニル-ウレイド)-酢酸、
- 5 (89) 5-{4-[4-({[4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメトキシ}-ニコチン酸メチルエステル、
- (90) 4-アミノ-3-{4-[4-({[4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメトキシ}-安息香酸、
- 10 (91) 3-{4-[4-({[4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメトキシ}-安息香酸、
- (92) 3-({4-[4-({[4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-アミノ)-安息香酸、
- 15 (93) 3-{4-[4-({[4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメトキシ}-4-ニトロ-安息香酸、
- (94) ((1H-ベンズイミダゾール-2-イルメチル)-{4-[4-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-アミノ)-酢酸、
- 20 (95) [フェニルカルバモイルメチル-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (96) [(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-(ピリジン-3-イルカルバモイルメチル)-アミノ]-酢酸、
- 25 (97) [[(4-ジメチルアミノ-フェニルカルバモイル)-メチル]-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- 30 (98) [[(4-メトキシ-フェニルカルバモイル)-メチル]-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

- (99) [[(イソプロピル-フェニル-カルバモイル)-メチル]-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (100) [(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-(ピリジン-2-イルカルバモイルメチル)-アミノ]-酢酸、
- 5 (101) [(2-オキソ-2-ピロリジン-1-イル-エチル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- 10 (102) [(4-メチル-チアゾール-2-イルメチル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (103) 4-(3-シクロヘキシルメチル-3-{4-[4-((イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ)-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-ウレイド)-安息香酸、
- 15 (104) 4-(3-イソブチル-3-{4-[4-((イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ)-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-ウレイド)-安息香酸、
- (105) (1-{4-[4-((イソブチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ)-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-3-メチル-3-フェニル-ウレイド)-酢酸、
- 20 (106) ({4-[4-((イソブチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ)-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-フェニルカルバモイルメチル-アミノ)-酢酸、
- 25 (107) ({4-[4-((イソブチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ)-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-[(4-イソプロピル-フェニルカルバモイル)-メチル]-アミノ)-酢酸、
- (108) 4-アセチルアミノ-3-{4-[4-((イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ)-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメトキシ}-安息香酸、
- 30 (109) 4-(2-ジメチルアミノ-アセチルアミノ)-3-{4-[4-((イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ)-メチル)-フェニル]-チア

ゾール-2-イルメトキシ}-安息香酸、

(1 1 0) ((1H-ベンズイミダゾール-2-イルメチル)-{4-[4-([4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ)-メチル]-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-アミノ)-酢酸、

- 5 (1 1 1) [(1H-ベンズイミダゾール-2-イルメチル)-(4-[4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

- (1 1 2) 3-{4-[4-([イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ)-メチル]-フェニル]-チアゾール-2-イルメトキシ}-4-メタンスルホ
10 ニルアミノ-安息香酸、

(1 1 3) 4-イソブチルアミノ-3-{4-[4-([イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ)-メチル]-フェニル]-チアゾール-2-イルメトキシ}-安息香酸、

- (1 1 4) 4-{4-[4-([4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ)-メチル]-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-3-オキソ-3, 4-ジ
15 ヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン-6-カルボン酸、

(1 1 5) 4-{4-[4-([4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ)-メチル]-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-3-オキソ-3, 4-ジ
ヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン-8-カルボン酸、

- 20 (1 1 6) ({4-[4-([イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ)-メチル]-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-{メチル-フェニル-アミノ-スルホニル}-アミノ)-酢酸、

- (1 1 7) ([4-イソプロピル-フェニルカルバモイル)-メチル]-{4-[4-([イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ)-メチル]-フェ
25 ニル]-チアゾール-2-イルメチル}-アミノ)-酢酸、

(1 1 8) ([3, 5-ジメチル-フェニルカルバモイル)-メチル]-{4-[4-([イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ)-メチル]-フェ
ニル]-チアゾール-2-イルメチル}-アミノ)-酢酸、

- (1 1 9) ([4-ジメチルアミノ-フェニルカルバモイル)-メチル]-{4-[4-([イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ)-メチル]-フェ
30 ニル]-チアゾール-2-イルメチル}-アミノ)-酢酸、

(1 2 0) ((ベンジルカルバモイル-メチル)-{4-[4-([イソプロピル-[4-

(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ)-酢酸、

(1 2 1) [{4-[4-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-[2-(モルホリン-4-イル)-2-オキソ-エチル]-アミノ]-酢酸、

(1 2 2) [{4-[4-({[4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-(2-フェノキシ-エチル)-アミノ]-酢酸、

(1 2 3) [{4-[4-({[4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-(2-フェニルアミノ-エチル)-アミノ]-酢酸、

(1 2 4) 2-カルボキシメトキシ-5-({4-[4-({[4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-メチル-アミノ)-安息香酸、

(1 2 5) 2-カルボキシメトキシ-5-[メチル-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-安息香酸、

(1 2 6) 3-{4-[4-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメトキシ}-4-(2-メチルアミノ-アセチルアミノ)-安息香酸、

(1 2 7) [(4-tert-ブチル-チアゾール-2-イルメチル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

(1 2 8) [フェニル-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

(1 2 9) [(2-フェノキシ-アセチル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

(1 3 0) [(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-(2-p-トリルオキシ-アセチル)-アミノ]-酢酸、

(1 3 1) (エトキシカルボニルメチル-{4-[4-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イル

メチル}-アミノ)-酢酸 二塩酸塩、

(132) ((4-tert-ブチル-チアゾール-2-イルメチル)-{4-[4-({[4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-アミノ)-酢酸、

5 (133) 6-{4-[4-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメトキシ}-ピリジン-2-カルボン酸、

(134) [(2-ベンジルオキシ-アセチル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

(135) [[2-(4-イソプロピル-フェノキシ)-アセチル]-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

(136) [(4,5-ジメチル-チアゾール-2-イルメチル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

(137) 5-(4-{5-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-チオフェン-2-イル}-チアゾール-2-イルメトキシ)-ニコチン酸、

(138) ((4-tert-ブチル-チアゾール-2-イルメチル)-{4-[6-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ}-メチル)-ベンゾオキサゾール-2-イル]-チアゾール-2-イルメチル}-アミノ)-酢酸、

(139) ((1H-ベンズイミダゾール-2-イルメチル)-{4-[6-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ}-メチル)-ベンゾオキサゾール-2-イル]-チアゾール-2-イルメチル}-アミノ)-酢酸、

25 (140) 5-{4-[6-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ}-メチル)-ベンゾオキサゾール-2-イル]-チアゾール-2-イルメトキシ}-ニコチン酸、

(141) [(5-tert-ブチル-チアゾール-2-イルメチル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

(142) [{4-[4-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-(2-オキソ-2-ピペリ

ジン-1-イル-エチル)-アミノ]-酢酸、

(1 4 3) 6-[メチル-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-ピリジン-2-カルボン酸、

(1 4 4) ({4-[6-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ}-メチル)-ベンゾオキサゾール-2-イル]-チアゾール-2-イルメチル}-アミノ)-酢酸、

(1 4 5) (S)-(カルボキシメチル-[4-[4-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ)-フェニル-酢酸、

10 (1 4 6) ((4,5-ジメチル-チアゾール-2-イルメチル)-{4-[4-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-アミノ)-酢酸、

(1 4 7) [(5-tert-ブチル-オキサゾール-2-イルメチル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

(1 4 8) [(1-メチル-1H-ベンズイミダゾール-2-イルメチル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

(1 4 9) (イソブトキシカルボニルメチル-[4-[4-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ)-酢酸 二塩酸塩、

(1 5 0) ({4-[4-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-プロポキシカルボニルメチル-アミノ)-酢酸 二塩酸塩、

25 (1 5 1) 1-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-ピペリジン-4-カルボン酸 塩酸塩、

(1 5 2) 1-{4-[4-({4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-ピペリジン-4-カルボン酸、

30 (1 5 3) 4-[4-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-ピペラジン-1-イル]-安息香酸、

(1 5 4) 4-(4-{4-[4-({4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピ

- ル-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル)-ピペラジン-1-イル)-安息香酸、
- (155) 2-[4-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-ピペラジン-1-イル]-安息香酸、
- 5 (156) 3-[4-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-ピペラジン-1-イル]-安息香酸、
- (157) 4-(4-{1-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-1H-インドール-3-イル}-チアゾール-2-イルメトキシ)-安息香酸、
- (158) 4-{4-[1-(4-イソプロピル-ベンジル)-5-(1-プロピル-ブチル)-1H-ベンズイミダゾール-2-イル]-チアゾール-2-イルメトキシ}-安息香酸、
- 10 (159) 4-{4-[1-(6-メチル-(ピリジン-2-イルメチル))-5-(1-プロピル-ブチル)-1H-ベンズイミダゾール-2-イル]-チアゾール-2-イルメトキシ}-安息香酸、
- (160) 2-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-1,2,3,4-テトラヒドロ-イソキノリン-7-カルボン酸、
- 15 (161) 4-[1-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-ピペリジン-4-イル]-安息香酸、
- (162) 3-[1-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-ピペリジン-4-イル]-安息香酸、
- 20 (163) 6-[(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-カルバモイル]-ニコチン酸、
- (164) 2-[1-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-ピペリジン-4-イル]-安息香酸、
- 25 (165) 1-(4-{1-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-1H-インドール-3-イル}-チアゾール-2-イルメチル)-ピペリジン-4-カルボン酸、
- (166) 2-(4-{1-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-1H-インドール-3-イル}-チアゾール-2-イルメチル)-1,2,3,4-テトラヒドロ-イソキノリン-7-カルボン酸、
- 30 (167) 3-[(4-{1-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-1H-インドール-3-イル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-安息香酸、
- (168) 6-[(2-アミノ-エチル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノ

キシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-カルバモイル]-ニコチン酸 塩酸塩、

(169) 2-(4-{1-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-1H-ベンズイミダゾール-2-イル}-チアゾール-2-イルメチル)-1,2,3,4-テトラヒドロ-イソキノリン-7-カルボン酸、

(170) 3-[4-(4-{1-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-1H-ベンズイミダゾール-2-イル}-チアゾール-2-イルメチル)-ピペラジン-1-イル]-安息香酸、

(171) 4-[1-(4-{1-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-1H-ベンズイミダゾール-2-イル}-チアゾール-2-イルメチル)-ピペリジン-4-イル]-安息香酸、

(172) 3-[4-(4-{1-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-1H-インドール-3-イル}-チアゾール-2-イルメチル)-ピペラジン-1-イル]-安息香酸、

(173) 3-(1-{4-[4-(3,4-ジクロロ-ベンジルオキシ)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-ピペリジン-4-イル)-安息香酸、

(174) 3-(1-{4-[4-(3,5-ビス-トリフルオロメチル-ベンジルオキシ)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-ピペリジン-4-イル)-安息香酸、

(175) 3-(1-{4-[4-(4-ブトキシ-ベンジルオキシ)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-ピペリジン-4-イル)-安息香酸、

(176) 5-メチル-2-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸、

(177) 5-メチル-1-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-1H-ピラゾール-3-カルボン酸、

(178) 5-tert-ブチル-1-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-1H-ピラゾール-3-カルボン酸、

(179) 5-tert-ブチル-2-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸、

(180) (2S,4R)-4-ヒドロキシ-1-(4-{1-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-1H-インドール-3-イル}-チアゾール-2-イルメチル)-ピロリジン-2-カルボン酸、

(181) 4-[4-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-ピペリジン-1-イル]-安息香酸、

- (182) 1-(4-{1-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-1H-インドール-3-イル}-チアゾール-2-イルメチル)-1H-インドール-3-カルボン酸、
- (183) 1-(4-{2-フェニル-1-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-1H-インドール-3-イル}-チアゾール-2-イルメチル)-ピペリジン-4-カルボン酸、
- 5 (184) 3-(1-{4-[4-(4-メチル-3-ニトロ-ベンジルオキシ)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-ピペリジン-4-イル)-安息香酸、
- (185) 2-{4-[1-(4-イソプロピル-ベンジル)-6-(モルホリン-4-イル)-1H-ベンズイミダゾール-2-イル]-チアゾール-2-イルメチル}-1,2,3,4-テトラヒドロ-イソキノリン-7-カルボン酸、
- 10 (186) 3-(4-{4-[1-(4-イソプロピル-ベンジル)-6-(モルホリン-4-イル)-1H-ベンズイミダゾール-2-イル]-チアゾール-2-イルメチル}-ピペラジン-1-イル)-安息香酸、
- (187) {ベンジル-[4-(4-{メチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-アミノ}-フェニル)-オキサゾール-2-イルメチル]-アミノ}-酢酸、
- 15 (188) 5-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメトキシ)-ニコチン酸、
- (199) 4-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメトキシ)-安息香酸、
- (190) 4-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]-フェニル}-
- 20 チアゾール-2-イルメチルチオ)-安息香酸、
- (191) 4-{4-[4-(4-シクロヘキシル-ベンジルオキシ)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチルチオ}-安息香酸、
- (192) 4-{4-[4-(4-シクロヘキシル-ベンジルオキシ)-フェニル]-チアゾール-2-イルメタンスルホニル}-安息香酸、
- 25 (193) 4-[メチル-(4-{5-メチル-2-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-スルファモイル]-安息香酸、
- (194) 4-[メチル-(4-{5-メチル-2-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-安息香酸、
- (195) (ベンジル-{4-[5-メチル-2-(4-トリフルオロメチル-ベンジルオキシ)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-アミノ)-酢酸、
- 30 (196) [ベンジル-(4-{5-メチル-2-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

- (197) [ベンジル-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (198) [ベンジル-(4-{4-[4-(1-エチル-プロピル)-ベンジルオキシ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- 5 (199) (ベンジル-{4-[5-tert-ブチル-2-(4-イソブチル-ベンジルオキシ)]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ)-酢酸、
- (200) [ベンジル-(4-{5-クロロ-2-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (201) [(4-{4-[4-(1-エチル-プロピル)-ベンジルオキシ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-(4-フルオロ-ベンジル)-アミノ]-酢酸、
- 10 (202) [(4-{4-[4-(1-エチル-プロピル)-ベンジルオキシ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-(4-イソプロピル-ベンジル)-アミノ]-酢酸、
- (203) [(4-{4-[4-(1-エチル-プロピル)-ベンジルオキシ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-(4-トリフルオロメチル-ベンジル)-アミノ]-酢酸、
- 15 酸、
- (204) [(4-クロロ-ベンジル)-(4-{4-[4-(1-エチル-プロピル)-ベンジルオキシ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (205) [(3,5-ジメチル-ベンジル)-(4-{4-[4-(1-エチル-プロピル)-ベンジルオキシ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- 20 (206) [(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-(ピリジン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (207) [(4-{4-[4-(1-エチル-プロピル)-ベンジルオキシ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-(ピリジン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (208) [(4-{5-メチル-2-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-(ピリジン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- 25 酸、
- (209) [ペンゾイル-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (210) [(4-{4-[4-(1-エチル-プロピル)-ベンジルオキシ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-(4-メチル-ペンゾイル)-アミノ]-酢酸、
- 30 (211) [(4-メトキシ-ペンゾイル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

- (2 1 2) 2-(4-{5-メチル-2-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-イソキノリン-3-カルボン酸、
- (2 1 3) (S)-2-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-イソキノリン-3-カルボン酸、
- (2 1 4) {ベンジル-[4-(4-{[4-(2, 2-ジメチル-プロピル)-ベンジル]-メチル-アミノ}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ}-酢酸、
- (2 1 5) {ベンジル-[4-(4-{[trans-4-(4-tert-ブチル-フェニル)-シクロヘキシルメチル]-メチル-アミノ}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ}-酢酸、
- (2 1 6) [ベンジル-(4-{4-[4-(シクロヘキシル-ベンジル)-メチル-アミノ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (2 1 7) 3-[ベンジル-(4-{4-[4-(シクロヘキシル-ベンジル)-メチル-アミノ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-プロピオン酸、
- (2 1 8) (ベンジル-{4-[4-(2-[4-(2, 2-ジメチル-プロピル)-フェニル]-エチル)-メチル-アミノ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ}-酢酸、
- (2 1 9) {ベンジル-[4-(4-{メチル-[4-(trans-4-メチル-シクロヘキシル)-ベンジル]-アミノ}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ}-酢酸、
- (2 2 0) {ベンジル-[4-(4-{[4-(cis-4-フルオロ-シクロヘキシル)-ベンジル]-メチル-アミノ}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ}-酢酸、
- (2 2 1) {ベンジル-[4-(4-{[trans-4-(4-クロロ-フェニル)-シクロヘキシルメチル]-メチル-アミノ}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ}-酢酸、
- (2 2 2) {ベンジル-[4-(4-{[4-(4, 4-ジメチル-シクロヘキシル)-ベンジル]-メチル-アミノ}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ}-酢酸、
- (2 2 3) {ベンジル-[4-(4-{メチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-アミノ}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ}-酢酸、
- (2 2 4) (ベンジル-{4-[4-(ピフェニル-4-イルメチル-メチル-アミノ)-

- フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ)-酢酸、
- (225) [ベンジル-(4-{4-[(4-シクロヘキシル-ベンジル)-メチル-アミノ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸ナトリウム、
- (226) [ベンジル-(4-{4-[(4-イソブチル-ベンジル)-メチル-アミノ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- 5 (227) {ベンジル-[4-(4-{メチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-アミノ}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ}-酢酸ナトリウム、
- (228) {ベンジル-[4-(4-{[4-(2,2-ジメチル-プロピルチオ)-ベンジル]-メチル-アミノ}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ}-酢酸、
- 10 (229) {ベンジル-[4-(4-{メチル-[4-(3-メチル-ブチルチオ)-ベンジル]-アミノ}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ}-酢酸、
- (230) [ベンジル-(4-{4-[(4-ジプロピルアミノ-ベンゾイル)-メチル-アミノ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (231) [(4-{4-[エチル-(4-イソプロピル-ベンジル)-アミノ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-(4-イソプロピル-ベンジル)-アミノ]-酢酸、
- 15 (232) [(4-イソプロピル-ベンジル)-(4-{4-[イソプロピル-(4-イソプロピル-ベンジル)-アミノ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (233) [(4-tert-ブチル-ベンジル)-(4-{4-[イソプロピル-(4-イソプロピル-ベンジル)-アミノ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- 20 (234) [(4-クロロ-ベンジル)-(4-{4-[(4-イソブチル-ベンジル)-メチル-アミノ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (235) [{4-[4-(ベンジル-メチル-アミノ)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-アミノ}-酢酸、
- 25 (236) [{4-[4-(ベンジル-メチル-アミノ)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-(4-クロロ-ベンジル)-アミノ]-酢酸、
- (237) [{4-[4-(ベンジル-メチル-アミノ)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-(2-クロロ-ベンジル)-アミノ]-酢酸、
- 30 (238) [{4-[4-(ベンジル-メチル-アミノ)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-(3,4-ジクロロ-ベンジル)-アミノ]-酢酸、
- (239) [{4-(4-{メチル-[4-(trans-4-メチル-シクロヘキシル)-ベンジ

ル]-アミノ}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-(ピリジン-2-イルメチル)-アミノ}-酢酸、

(240) {[4-(4-{メチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-アミノ}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-(ピリジン-2-イルメチル)-アミノ}-

5 酢酸、

(241) ({4-[4-(ベンジル-メチル-アミノ)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-ナフタレン-1-イルメチル-アミノ)-酢酸、

(242) ({4-[4-(ベンジル-メチル-アミノ)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-キノリン-2-イルメチル-アミノ)-酢酸、

10 (243) ((2-ベンゾ[b]チオフェン-3-イル-アセチル)-{4-[4-(ベンジル-メチル-アミノ)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-アミノ)-酢酸、

(244) [[2-(4-クロロ-フェニル)-アセチル]-(4-{4-[(4-イソブチル-ベンジル)-メチル-アミノ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

15 (245) {(4-{4-[(4-イソブチル-ベンジル)-メチル-アミノ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-[2-(4-イソプロピル-フェニル)-アセチル]-アミノ}-酢酸、

(246) [(4-{4-[(4-イソブチル-ベンジル)-メチル-アミノ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-(3-メチル-ブチル)-アミノ]-酢酸、

20 (247) {1-[4-(4-{[4-(2,2-ジメチル-プロピル)-ベンジル]-メチル-アミノ}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-3-フェニル-ウレイド}-酢酸、

(248) [ベンゾイル-(4-{4-[(4-イソブチル-ベンジル)-メチル-アミノ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

(249) {(4-メチル-ベンゾイル)-[4-(4-{メチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-アミノ}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ}-酢酸、

(250) {(4-イソプロピル-ベンゾイル)-[4-(4-{メチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-アミノ}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ}-酢酸ナトリウム、

30 (251) (S)-{3-[4-(4-{メチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-アミノ}-フェニル)-チアゾール-2-イル]-3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-イル}-酢酸ナトリウム、

- (252) 1-(4-{4-[(4-シクロヘキシル-ベンジル)-メチル-アミノ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-ピペリジン-4-カルボン酸、
- (253) 1-(4-{4-[(4-シクロヘキシル-ベンジル)-メチル-アミノ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-ピペリジン-3-カルボン酸、
- 5 (254) 1-(4-{4-[(4-シクロヘキシル-ベンジル)-メチル-アミノ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-4-フェニル-ピペリジン-4-カルボン酸、
- (255) 1-(4-{4-[(4-シクロヘキシル-ベンジル)-メチル-アミノ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-4-(3-メチル-ブチル)-ピペリジン-4-カルボン酸、
- 10 (256) 1-[4-(4-{メチル-[4-(trans-4-メチル-シクロヘキシル)-ベンジル]-アミノ})-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-4-フェニル-ピペリジン-4-カルボン酸、
- (257) 1-[4-(4-{[trans-4-(4-クロロ-フェニル)-シクロヘキシルメチル]-メチル-アミノ})-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-4-フェニル-ピ
- 15 ペリジン-4-カルボン酸、
- (258) 2-[4-(4-{メチル-[4-(trans-4-メチル-シクロヘキシル)-ベンジル]-アミノ})-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-1,2,3,4-テトラヒドロ-イソキノリン-3-カルボン酸、
- (259) 2-(4-{4-[(4-イソブチル-ベンジル)-メチル-アミノ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-1,2,3,4-テトラヒドロ-イソキノリン-3-カル
- 20 ルボン酸、
- (260) 2-[4-(4-{メチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-アミノ})-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-1,2,3,4-テトラヒドロ-イソキノリン-3-カルボン酸、
- 25 (261) 2-[4-(4-{[4-(2,2-ジメチル-プロピル)-ベンジル]-メチル-アミノ})-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-1,2,3,4-テトラヒドロ-イソキノリン-3-カルボン酸、
- (262) 5-[(4-{4-[(4-シクロヘキシル-ベンジル)-メチル-アミノ]}-フェニル)-チアゾール-2-イル)-メチル-アミノ]-メチル)-フラン-2-カルボン
- 30 酸、
- (263) 2-[4-(4-{4-[(4-シクロヘキシル-ベンジル)-メチル-アミノ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-3-フェニル-プロピオン酸、

- (264) [(4-{4-[(4-シクロヘキシル-ベンジル)-メチル-アミノ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ]-フェニル-酢酸、
- (265) 2-[(4-{4-[(4-シクロヘキシル-ベンジル)-メチル-アミノ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ]-プロピオン酸、
- 5 (266) 3-(4-クロロ-フェニル)-2-[(4-{4-[(4-イソブチル-ベンジル)-メチル-アミノ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ]-プロピオン酸、
- (267) [(4-{4-[(4-シクロヘキシル-ベンジル)-メチル-アミノ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-メチル-アミノ]-酢酸、
- 10 (268) 3-[(4-{4-[(4-シクロヘキシル-ベンジル)-メチル-アミノ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-メチル-アミノ]-プロピオン酸、
- (269) 4-[(4-{4-[(4-シクロヘキシル-ベンジル)-メチル-アミノ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-メチル-アミノ]-メチル]-安息香酸、
- (270) 4-[(4-{4-[(4-シクロヘキシル-ベンジル)-メチル-アミノ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-メチル-アミノ]-安息香酸、
- 15 (271) 6-[(4-{4-[(4-シクロヘキシル-ベンジル)-メチル-アミノ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-メチル-アミノ]-ニコチン酸、
- (272) 2-[(4-{4-[(4-イソブチル-ベンジル)-メチル-アミノ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-メチル-アミノ]-3-フェニル-プロピオン酸、
- 20 (273) (S)-2-{メチル-[4-(4-{メチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-アミノ})-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ}-3-フェニル-プロピオン酸、
- (274) (S)-{メチル-[4-(4-{メチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-アミノ})-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ}-フェニル-酢酸、
- 25 酸、
- (275) {[4-(4-{[4-(2,2-ジメチル-プロピル)-ベンジル]-メチル-アミノ})-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-メチル-アミノ}-フェニル-酢酸、
- (276) 2-{[4-(4-{[4-(2,2-ジメチル-プロピル)-ベンジル]-メチル-アミノ})-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-メチル-アミノ}-3-フェニル-プロピオン酸、
- 30 (277) {カルボキシメチル-[4-(4-{メチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-アミノ})-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ}-酢酸、

- (278) [(4-{4-[(4-シクロヘキシル-ベンジル)-メチル-アミノ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-(3-メチル-ブチル)-アミノ]-酢酸、
- (279) {(3-メチル-ブチル)-[4-(4-{メチル-[4-(trans-4-メチル-シクロヘキシル)-ベンジル]}-アミノ)}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-ア
5 ミノ}-酢酸、
- (280) [(4-{4-[(4-イソブチル-ベンジル)-メチル-アミノ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-(3-メチル-ブチル)-アミノ]-酢酸、
- (281) 5-[4-(4-{メチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]}-アミノ)-
フェニル)-チアゾール-2-イルメトキシ]-ニコチン酸、
- 10 (282) 4-[4-(4-{メチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]}-アミノ)-
フェニル)-チアゾール-2-イルメトキシ]-安息香酸、
- (283) 4-[4-(4-{メチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]}-アミノ)-
フェニル)-チアゾール-2-イルメチルチオ]-安息香酸、
- (284) 4-[(4-{4-[(4-シクロヘキシル-ベンジル)-メチル-アミノ]}-フェ
15 ニル)-チアゾール-2-イルメチル)-スルファモイル]-安息香酸、
- (285) 4-{[4-(4-{[4-(4,4-ジメチル-シクロヘキシル)-ベンジル]-メチ
ル-アミノ}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-メチル-スルファモイ
ル}-安息香酸、
- (286) {[4-(4-{[4-(4,4-ジメチル-シクロヘキシル)-ベンジル]-メチ
20 ル-アミノ}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-メチル-スルファモイ
ル}-酢酸、
- (287) 4-[(4-{4-[(4-シクロヘキシル-ベンジル)-メチル-アミノ]}-フェ
ニル)-チアゾール-2-イルメチル)-メチル-スルファモイル]-安息香酸、
- (288) 3-[(4-{4-[(4-シクロヘキシル-ベンジル)-メチル-アミノ]}-フェ
25 ニル)-チアゾール-2-イルメチル)-メチル-スルファモイル]-安息香酸、
- (289) [(4-{4-[(4-シクロヘキシル-ベンジル)-メチル-アミノ]}-フェニ
ル)-チアゾール-2-イルメチル)-メチル-スルファモイル]-酢酸、
- (290) 4-{[4-(4-{[4-(4,4-ジメチル-シクロヘキシル)-ベンジル]-メチ
ル-アミノ}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-メチル-スルファモイ
30 ル}-酢酸、
- (291) [(4-{4-[(4-シクロヘキシル-ベンジル)-メチル-アミノ]}-フェニ
ル)-チアゾール-2-イルメチル)-イソブチル-スルファモイル]-酢酸、

- (292) N-(4-{4-[(4-シクロヘキシル-ベンジル)-メチル-アミノ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-オキサミド酸、
- (293) {ベンジル-[4-(4-{4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-メチル-アミノカルボニル}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ}-酢酸、
- 5 (294) N-(4-{4-[(4-シクロヘキシル-ベンジル)-メチル-アミノ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-N-メチル-テレフタルアミド酸、
- (295) {ベンジル-[4-(4-{メチル-[4-(trans-4-メチル-シクロヘキシル)-ベンジル]-アミノ}-フェニル)-チアゾール-2-イルメトキシカルボニル]-アミノ}-酢酸、
- 10 (296) [3-(4-{4-[(4-シクロヘキシル-ベンジル)-メチル-アミノ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-3-メチル-ウレイド]-酢酸、
- (297) (シクロヘキシルメチル-{4-[6-(3,4-ジクロロ-ベンジルオキシ)-ベンゾオキサゾール-2-イル]}-チアゾール-2-イル)-アミノ)-酢酸、
- (298) [4-(4-{4-[(4-シクロヘキシル-ベンジル)-メチル-アミノ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-ピペラジン-1-イル]-酢酸、
- 15 (299) (S)-2-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-1,2,3,4-テトラヒドロ-イソキノリン-3-カルボン酸ナトリウム、
- (300) 5-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメトキシ)-ニコチン酸ナトリウム、
- 20 (301) 5-(4-{2-メチル-4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメトキシ)-ニコチン酸、
- (302) 5-(4-{3-メトキシ-4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメトキシ)-ニコチン酸、
- 25 (303) [(4-{2-メチル-4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-フェニルカルバモイルメチル-アミノ]-酢酸、
- (304) [[(4-イソプロピル-フェニルカルバモイル)-メチル]-(4-{2-メチル-4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]}-フェニル)-チアゾール-
- 30 2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (305) 2-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-1,2,3,4-テトラヒドロ-イソキノリン-3-カルボ

ン酸、

(306) [(4-{3-メトキシ-4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-フェニルカルバモイルメチル-アミノ]-酢酸、

- 5 (307) [(4-イソプロピル-フェニルカルバモイル)-メチル]-(4-{3-メトキシ-4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

(308) [(4-{2-メチル-4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-チアゾール-4-イルメチル-アミノ]-酢

- 10 酸、

(309) [(4-{2-メチル-4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-(2-メチル-チアゾール-4-イルメチル)-アミノ]-酢酸 塩酸塩、

- (310) [(ベンジルカルバモイル)-メチル]-(4-{2-メチル-4-[4-(1-プロ
15 ピル-ブチル)-ベンジルオキシ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-ア
ミノ]-酢酸 塩酸塩、

(311) [(1H-ベンズイミダゾール-2-イルメチル)-(4-{2-メチル-4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

- 20 (312) [(4-tert-ブチル-チアゾール-2-イルメチル)-(4-{1-[4-(1-プロ
ピル-ブチル)-ベンジル]}-1,2,3,4-テトラヒドロ-キノリン-6-イル)-チアゾ
ール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

(313) 1-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]}-フェニル)-
チアゾール-2-イルメチル)-ピペリジン-4-カルボン酸 塩酸塩、

- 25 (314) 4-[4-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]}-フェニ
ル)-チアゾール-2-イルメチル)-ピペラジン-1-イル]-安息香酸、

(315) 4-{4-[5-(1-エチル-プロピル)-1-(4-イソプロピル-ベンジル)]-
1H-ベンズイミダゾール-2-イル]-チアゾール-2-イルメトキシ}-安息香酸エ
チルエステル、

- 30 (316) 4-{4-[5-(1-エチル-プロピル)-1-(4-イソプロピル-ベンジル)]-
1H-ベンズイミダゾール-2-イル]-チアゾール-2-イルメトキシ}-安息香酸、

(317) 4-{4-[1-(4-アセチル-ベンジル)-5-(1-エチル-プロピル)-1H-ベ

- ンズイミダゾール-2-イル]-チアゾール-2-イルメトキシ}-安息香酸、
 (318) 4-{4-[1-(4-アセチル-ベンジル)-6-(1-エチル-プロピル)-1H-ベンズイミダゾール-2-イル]-チアゾール-2-イルメトキシ}-安息香酸、
 (319) 4-{4-[1-シクロヘキシルメチル-5-(1-エチル-プロピル)-1H-ベンズイミダゾール-2-イル]-チアゾール-2-イルメトキシ}-安息香酸、
 5 (320) [(1-メチル-1H-ベンズイミダゾール-2-イルメチル)-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
 (321) 5-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメトキシ)-ニコチン酸、
 10 (322) 5-{4-[4-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ}-メチル)-フェニル]-チオフェン-2-イルメトキシ}-ニコチン酸、
 (323) 5-{4-[4-({[4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ}-メチル)-フェニル]-チオフェン-2-イルメトキシ}-ニコチン酸、
 15 (324) 5-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメトキシ)-ニコチン酸、
 (325) [(1H-ベンズイミダゾール-2-イルメチル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
 20 (326) 6-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメトキシ)-ピリジン-2-カルボン酸、
 (327) [(1H-ベンズイミダゾール-2-イルメチル)-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
 25 (328) [[(4-イソプロピル-フェニルカルバモイル)-メチル]-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
 (329) [フェニルカルバモイルメチル-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
 30 (330) ({4-[4-({[4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ}-メチル)-フェニル]-チオフェン-2-イルメチル}-フェニルカルバモイルメチル)-アミノ)-酢酸、

(331) ((4-tert-ブチル-チアゾール-2-イルメチル)-{4-[4-({[4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ}-メチル)-フェニル]-チオフェン-2-イルメチル}-アミノ)-酢酸、

(332) [(5-tert-ブチル-チアゾール-2-イルメチル)-(4-{4-[4-(1-プロ
5 ピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

(333) ((1H-ベンズイミダゾール-2-イルメチル)-{4-[4-({[4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ}-メチル)-フェニル]-チオ
フェン-2-イルメチル}-アミノ)-酢酸、

10 (334) [(4-tert-ブチル-チアゾール-2-イルメチル)-(4-{4-[4-(1-プロ
ピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-ア
ミノ]-酢酸、

(335) [フェニルカルバモイルメチル-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-
フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

15 (336) 5-{5-[4-({[4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-
アミノ}-メチル)-フェニル]-チオフェン-2-イルメトキシ}-ニコチン酸、

(337) 5-{5-[4-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-
アミノ}-メチル)-フェニル]-チオフェン-2-イルメトキシ}-ニコチン酸、

(338) ((4-tert-ブチル-チアゾール-2-イルメチル)-{5-[4-({[4-(1-エ
20 チル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ}-メチル)-フェニル]-チ
オフェン-2-イルメチル}-アミノ)-酢酸、

(339) ((4-tert-ブチル-チアゾール-2-イルメチル)-{5-[4-({イソプロ
ピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ}-メチル)-フェニル]-チ
オフェン-2-イルメチル}-アミノ)-酢酸、

25 (340) ((1H-ベンズイミダゾール-2-イルメチル)-{5-[4-({[4-(1-エチ
ル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ}-メチル)-フェニル]-チオ
フェン-2-イルメチル}-アミノ)-酢酸、

(341) ((1H-ベンズイミダゾール-2-イルメチル)-{5-[4-({イソプロピ
ル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ}-メチル)-フェニル]-チオ
30 フェン-2-イルメチル}-アミノ)-酢酸、

(342) [(4,5-ジメチル-チアゾール-2-イルメチル)-(4-{4-[4-(1-プロ
ピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-

アミノ]-酢酸、

(343) (S)-2-{4-[4-({[4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ}-メチル)-フェニル]-チオフェン-2-イルメチル}-1,2,3,4-テトラヒドロ-イソキノリン-3-カルボン酸、

- 5 (344) {{4-[4-({[4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ}-メチル)-フェニル]-チオフェン-2-イルメチル}-[(4-イソプロピル-フェニルカルバモイル)-メチル]-アミノ}-酢酸、

- (345) (S)-2-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-1,2,3,4-テトラヒドロ-イソキノリン-3-カルボン酸、

(346) [[(4-イソプロピル-フェニルカルバモイル)-メチル]-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

- (347) (S)-2-{5-[4-({[4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ}-メチル)-フェニル]-チオフェン-2-イルメチル}-1,2,3,4-テトラヒドロ-イソキノリン-3-カルボン酸、

(348) [(5-tert-ブチル-オキサゾール-2-イルメチル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

- 20 (349) [(1-メチル-1H-ベンズイミダゾール-2-イルメチル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

(350) 6-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメトキシ)-ピリジン-2-カルボン酸、

- 25 (351) 6-{4-[4-({[4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ}-メチル)-フェニル]-チオフェン-2-イルメトキシ}-ピリジン-2-カルボン酸、

- (352) ((5-tert-ブチル-チアゾール-2-イルメチル)-{4-[4-({[4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ}-メチル)-フェニル]-チオフェン-2-イルメチル}-アミノ)-酢酸、

30 (353) [{4-[4-({[4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ}-メチル)-フェニル]-チオフェン-2-イルメチル}-(1-メチル-1H-ベン

ズイミダゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

(354) [(4-tert-ブチル-チアゾール-2-イルメチル)-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

- 5 (355) [{5-[4-({4-(1-エチル-プロピル)-フェニル}-イソプロピル-アミノ)-メチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-(1-メチル-1H-ベンズイミダゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

(356) [(5-tert-ブチル-チアゾール-2-イルメチル)-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

- 10 (357) [(1-メチル-1H-ベンズイミダゾール-2-イルメチル)-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸ナトリウム、

- (358) ビス {[(1-メチル-1H-ベンズイミダゾール-2-イルメチル)-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸} カルシウム、

(359) [(1-メチル-1H-ベンズイミダゾール-2-イルメチル)-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸 トルエン-4-スルホン酸塩、

- 20 (360) 5-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメトキシ)-ニコチン酸 硫酸塩、

(361) [(1-メチル-1H-ベンズイミダゾール-2-イルメチル)-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-カルボニル)-アミノ]-酢酸、

- 25 (362) [(5-tert-ブチル-チアゾール-2-イルメチル)-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-カルボニル)-アミノ]-酢酸、

(363) [(4-イソプロピル-ベンジル)-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-カルボニル)-アミノ]-酢酸、

- 30 (364) [(4-ジメチルアミノ-ベンジル)-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-カルボニル)-アミノ]-酢酸、

- (365) [(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]}-フェニル)-チオフェン-2-カルボニル)-(ピリジン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (366) [(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]}-フェニル)-チオフェン-2-カルボニル)-ピリジン-3-イルメチル-アミノ]-酢酸、
- 5 (367) 5-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]}-フェニル)-チオフェン-2-イルメトキシ)-ニコチン酸 メタンスルホン酸塩、
- (368) [メタンスルホニル-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]}-フェニル)-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (369) 5-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]}-フェニル)-チオフェン-2-イルメトキシ)-ニコチン酸ナトリウム、
- 10 (370) 5-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]}-フェニル)-チオフェン-2-イルメトキシ)-ニコチン酸 塩酸塩、
- (371) 4-[4-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]}-フェニル)-チオフェン-2-カルボニル)-ピペラジン-1-イル]-安息香酸、
- 15 (372) 4-[1-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]}-フェニル)-チオフェン-2-カルボニル)-ピペリジン-4-イル]-安息香酸、
- (373) [(1-メチル-1H-ベンズイミダゾール-2-イルメチル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]}-フェニル)-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸 塩酸塩、
- 20 (374) [(1-メチル-1H-ベンズイミダゾール-2-イルメチル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]}-フェニル)-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸 硫酸塩、
- (375) 4-(2-ジメチルアミノ-アセチルアミノ)-3-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]}-フェニル)-チオフェン-2-イルメトキシ)-
- 25 安息香酸、
- (376) 4-イソブチリルアミノ-3-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]}-フェニル)-チオフェン-2-イルメトキシ)-安息香酸、
- (377) 4-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]}-フェニル)-チオフェン-2-イルメトキシ)-安息香酸、
- 30 (378) 4-(メタンスルホニル-メチル-アミノ)-3-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]}-フェニル)-チオフェン-2-イルメトキシ)-安息香酸、

- (379) 4-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチルチオ)-安息香酸、
- (380) 4-アミノ-3-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメトキシ)-安息香酸、
- 5 (381) 1-[5-[1-(4-シクロヘキシル-ベンジル)-1H-インドール-3-イル]-チオフェン-2-イルメチル]-4-フェニル-ピペリジン-4-カルボン酸 塩酸塩、
- (382) (ベンジル-{5-[1-(4-シクロヘキシル-ベンジル)-1H-インドール-3-イル]-チオフェン-2-イルメチル}-アミノ)-酢酸 塩酸塩、
- 10 (383) [(メチル-フェニル-スルファモイル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (384) [(5-tert-ブチル-チアゾール-2-イルメチル)-(5-{4-[4-(シクロヘキシル-フェニル)-メチル-カルバモイル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- 15 (385) [(5-{4-[4-(シクロヘキシル-ベンジル)-エチル-アミノ]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-(ピリジン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (386) [(5-{4-[4-(シクロヘキシル-ベンジル)-エチル-アミノ]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-(2-フェノキシ-エチル)-アミノ]-酢酸、
- 20 (387) 4-{1-[4-(4-{[trans-4-(4-tert-ブチル-フェニル)-シクロヘキシルメチル]-エチル-アミノ}-フェニル)-チオフェン-2-イルメチル]-ピペリジン-4-イル}-安息香酸、
- (388) [[2-(4-イソプロピル-フェノキシ)-アセチル]-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- 25 (389) [(4-イソプロピル-ベンゾイル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (390) [(3-メチル-ブチル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- 30 (391) [3-メチル-3-フェニル-1-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-ウレイド]-酢酸、

- (392) 2-(4-{3-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-1,2,3,4-テトラヒドロ-イソキノリン-7-カルボン酸、
- (393) 4-[4-(5-{4-[4-(trans-4-メチル-シクロヘキシル)-ベンジルオキシ]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-ピペラジン-1-イル]-安息香酸、
- (394) [(2-クロロ-5-トリフルオロメチル-ベンジル)-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- 10 (395) 3-{[カルボキシメチル-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-メチル}-安息香酸、
- (396) [(4-メトキシ-ベンジル)-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- 15 (397) [(4-メチルチオ-ベンジル)-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (398) 4-[シクロヘキシルメチル-(5-{4-[4-(trans-4-メチル-シクロヘキシル)-ベンジルオキシ]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-スルファモイル]-安息香酸、
- 20 (399) 4-[3-シクロヘキシルメチル-3-(5-{4-[4-(trans-4-メチル-シクロヘキシル)-ベンジルオキシ]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-ウレイド]-安息香酸、
- (400) [ベンズヒドリル-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- 25 (401) [[2-オキソ-2-(4-ピロリジン-1-イル-フェニル)-エチル]-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸エチルエステル 塩酸塩、
- (402) [(1-メチル-1H-ベンズイミダゾール-2-イルメチル)-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸エチルエステル、
- 30 (403) 3-(ベンジル-{5-[1-(4-シクロヘキシル-ベンジル)-2,3-ジヒドロ-1H-インドール-5-イル]-チオフェン-2-イルメチル}-アミノ)-プロピオ

ン酸、

(404) [ベンジル-(4-{4-[2-(2,2-ジメチル-プロピル)-ベンズイミダゾール-1-イルメチル]}-フェニル)-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

(405) [(1-メチル-1H-インドール-3-イルメチル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]}-フェニル)-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

(406) [(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]}-フェニル)-チオフェン-2-イルメチル)-キノリン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

(407) [ベンゾチアゾール-2-イルメチル-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]}-フェニル)-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

(408) [(1-ベンジル-1H-イミダゾール-2-イルメチル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]}-フェニル)-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

(409) [(1H-インドール-5-イルメチル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]}-フェニル)-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

(410) [(4-イミダゾール-1-イル-ベンジル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]}-フェニル)-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

(411) [ベンゾフラン-2-イルメチル-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]}-フェニル)-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

(412) [[2,2']-ピチオフェニル-5-イルメチル-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]}-フェニル)-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

(413) [(2-フェニル-1H-イミダゾール-4-イルメチル)-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]}-フェニル)-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

(414) [(3-フェニル-1H-ピラゾール-4-イルメチル)-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]}-フェニル)-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

(415) [ベンゾオキサゾール-2-イルメチル-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブ

チル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-
酢酸、

(416) [ベンゾ[b]チオフェン-2-イルメチル-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブ
チル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-
5 酢酸、

(417) [(4-フェニル-チオフェン-2-イルメチル)-(5-{4-[4-(1-プロピ
ル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-ア
ミノ]-酢酸、

(418) [ベンゾチアゾール-2-イル-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フ
10 エノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

(419) [(5-クロロ-チオフェン-2-スルホニル)-(5-{4-[4-(1-プロピル-
ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミ
ノ]-酢酸、

(420) [(1-ジエチルカルバモイルメチル-1H-ベンズイミダゾール-2-イ
15 ルメチル)-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-
チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

(421) (S)-({4-[2-(4-シクロヘキシル-ベンジルオキシ)-5-メチル-フ
エニル]-チオフェン-2-イルメチル}-メチル-アミノ)-3-フェニル-プロピ
ン酸、

20 (422) [ベンジル-(4-{4-[4-(4-ブトキシ-ベンゼンスルホニル)-エチル-
アミノ]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

(423) N-{4-[2-(4-シクロヘキシル-ベンジルオキシ)-5-メチル-フェニ
ル]-チオフェン-2-イルメチル}-N-(2-メチル-ベンゾチアゾール-6-イル)-
オキサミド酸、

25 (424) (ベンジル-{4-[4-(3,5-ジクロロ-フェノキシメチル)-フェニ
ル]-チオフェン-2-イルメチル}-アミノ)-酢酸、

(425) [(1-アリル-1H-ベンズイミダゾール-2-イルメチル)-(5-{4-[4-
(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメ
チル)-アミノ]-酢酸及び

30 (426) [[4-(4-クロロ-フェニル)-チアゾール-2-イル]-(5-{4-[4-(1-ブ
ロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチ
ル)-アミノ]-酢酸。

24. 以下の化合物からなる群より選択される上記 [1] 乃至 [23] のいずれかに記載の複素芳香 5 員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩。

- (1) (S)-2-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン-3-カルボン酸、
- (2) {[4-[4-({[4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-[(4-イソプロピル-フェニルカルバモイル)-メチル]-アミノ}-酢酸、
- (3) 4-(3-イソブチル-3-{4-[4-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-ウレイド)-安息香酸、
- (4) ({4-[4-({イソブチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-フェニルカルバモイルメチル-アミノ)-酢酸、
- (5) [(4-イソプロピル-フェニルカルバモイル)-メチル]-{4-[4-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-アミノ}-酢酸、
- (6) [(4-tert-ブチル-チアゾール-2-イルメチル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (7) [(4, 5-ジメチル-チアゾール-2-イルメチル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (8) [(5-tert-ブチル-チアゾール-2-イルメチル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (9) [[2-(4-イソプロピル-フェノキシ)アセチル]-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

- (10) 4-[4-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-ピペラジン-1-イル]-安息香酸、
- (11) {ベンジル-[4-(4-{メチル-[4-(1-プロピル-ブチル)ベンジル]アミノ}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ}-酢酸、
- (12) [(1-メチル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イルメチル)-5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- 10 (13) 5-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメトキシ)-ニコチン酸、
- (14) [(1H-ベンゾイミダゾール-2-イルメチル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- 15 (15) [(1H-ベンゾイミダゾール-2-イルメチル)-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (16) [(4-イソプロピル-フェニルカルバモイル)-メチル]-5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- 20 (17) (S)-2-{4-[4-({[4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ}-メチル)-フェニル]-チオフェン-2-イルメチル}-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-イソキノリン-3-カルボン酸、
- 25 (18) {[4-[4-({[4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ}-メチル)-フェニル]-チオフェン-2-イルメチル}-[(4-イソプロピル-フェニルカルバモイル)-メチル]-アミノ]-酢酸、
- 30 (19) [(1-メチル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イルメチル)-5-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸及び

(20) [(4-tert-ブチル-チアゾール-2-イルメチル) - (5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸。

5 [25] 上記[1]乃至[24]のいずれかに記載の複素芳香5員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩と医薬上許容し得る担体とを含有する医薬組成物。

[26] 上記[1]乃至[24]のいずれかに記載の複素芳香5員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩と医薬上許容し得る担体とを含有する受容体型チロシンキナーゼネガティブ調節因子阻害用医薬組成物。

[27] 上記[1]乃至[24]のいずれかに記載の複素芳香5員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩と医薬上許容し得る担体とを含有する蛋白質チロシンホスファターゼ1B阻害用医薬組成物。

15 [28] 上記[1]乃至[24]のいずれかに記載の複素芳香5員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩と医薬上許容し得る担体とを含有する糖尿病予防又は治療用医薬組成物。

[29] 上記[1]乃至[24]のいずれかに記載の複素芳香5員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩と医薬上許容し得る担体とを含有する高脂血症予防又は治療用医薬組成物。

20 [30] 上記[1]乃至[24]のいずれかに記載の複素芳香5員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩と医薬上許容し得る担体とを含有する肥満症予防又は治療用医薬組成物。

[31] 上記[1]乃至[24]のいずれかに記載の複素芳香5員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩と医薬上許容し得る担体とを含有する糖尿病合併症予防又は治療用医薬組成物。

[32] 高脂血症治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする上記[25]記載の医薬組成物。

30 [33] 高脂血症治療薬が、HMG-CoA レダクターゼ阻害剤(スタチン)、フィブラート、TNFSF6 発現阻害剤、HDL-コレステロール増加剤、アポ A1 発現増強剤、SPP1 (オステオポンチン) 発現阻害剤、ペルオキシソーム

増殖因子活性化受容体 (PPAR) に作用する薬剤、PPAR α 作動剤、リパーゼ
 清澄化因子刺激剤、コレステロール拮抗剤、血小板凝固拮抗剤、抗酸化
 剤、コレステロール生合成阻害剤、LDL-受容体アップレギュレーター、
 胆汁酸封鎖剤、コレステロール吸収阻害剤及びニコチン酸からなる群よ
 5 り選択される 1 以上の薬剤である上記 [32] 記載の医薬組成物。

[34] 高脂血症治療薬が、ロバスタチン、プラバスタチン (エプタ
 スタチン) ナトリウム、フルバスタチン (フルインドスタイニン) ナトリ
 ウム、ロスバスタチンカルシウム、アトルバスタチンカルシウム、シン
 バスタチン (シンビノリン)、ピタバスタチン (イタバスタチン、ニスバ
 10 スタチン) カルシウム、ロニフィブラート (ロニフィブラート)、ビニフ
 ィブラート (ビニフィブラート)、クリノフィブラート、シプロフィブラ
 ート、クロフィブラート、エトフィブラート、フェノフィブラート、ベ
 ザフィブラート、ゲンフィブロジル、アシピモクス、エイコサペンタエ
 ン酸 (イコサペント、イコペネート、イコサペント酸) エチルエステル、
 15 プロブコール、ポリコサノール、塩酸コレセペラム、コレスチラミン
 (コレスチラミン樹脂)、塩酸コレスチボール、コレスチミド (コレスチ
 ラン)、エゼチミブ及びナイアシン (ニコチン酸) からなる群より選択さ
 れる 1 以上の薬剤である上記 [33] 記載の医薬組成物。

[35] 糖尿病治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする上記
 20 [25] 記載の医薬組成物。

[36] 糖尿病治療薬が、インスリン分泌促進剤、ビッグアナイド剤、
 α -グルコシダーゼ阻害剤、インスリン製剤、インスリンアナログ、イン
 スリン感受性増強剤、IL-11、抗 CD25 (IL-2 受容体) 剤、アンギオテン
 シン (AT1) 拮抗剤、アンギオテンシン変換酵素 (ACE) 阻害剤、アルドース
 25 レダクターゼ阻害剤、抗酸化剤、カルニチンアセチルトランスフェラー
 ゼ刺激剤、抗鬱剤、グルココルチコイド、レチリン、ラジカル形成作動
 剤及びトランスケトラーゼ活性化剤からなる群より選択される 1 以上の
 薬剤である上記 [35] 記載の医薬組成物。

[37] 糖尿病治療薬が、ナテグリニド、グリメピリド、グリベンク
 30 ラミド、グリクラジド、アセトヘキサミド、トルブタミド、グリクロピ
 ラミド、トラザミド、グリブゾール、グリピジド、グルボルヌリド、グ
 リキドン、レパグリニド、塩酸メトホルミン、塩酸ブホルミン、ボグリ

ボース、アカルボース、エパルレスタット、ミグリトール、インスリン、塩酸ピオグリタゾン、マレイン酸ロシグリタゾン、ピコリン酸クロム/ビオチン、V-411、組換えヒトインターロイキン-11、ダシリキシマブ（ダシリツマブ）、ロサルタンカリウム、カプトプリル、塩酸イミダプリル、
5 α -リポ酸、塩酸レバセカルニン（アセチル-L-カルニチン、アセチルレボカルニチン）、カプトプリル、レチリン、ベルテボルフイン、ベンフォチアミン及びフルオシノロンアセトニドからなる群より選択される1以上の薬剤である上記〔36〕記載の医薬組成物。

〔38〕 肥満症治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする上記
10 〔25〕記載の医薬組成物。

〔39〕 肥満症治療薬が、マジンドール、リパーゼ阻害剤、5-HT/ノルエピネフリン再取り込みデュアルインヒビター、5-HT再取り込み阻害剤、ハーバルエフェドリン及びカフェインを含むサプリメント、ヒト絨毛性性腺刺激ホルモン、アドレナリン受容体作動剤、メタアンフェタミン、
15 フェンタミン及びアムフェプラモンからなる群より選択される1以上の薬剤である上記〔38〕記載の医薬組成物。

〔40〕 肥満症治療薬が、マジンドール、オルリスタット、塩酸シブトラミン水和物、塩酸フルオキセチン、絨毛性性腺刺激ホルモン（ヒト）、NCPシステムを用いるVNS療法、メタラミノール、塩酸d-メタアン
20 フェタミン、フェンテルミン、塩酸アムフェプラモン（ジエチルプロピオン）、塩酸ベンズフェタミン及び酒石酸フェンジメトラジンからなる群より選択される1以上の薬剤である上記〔39〕記載の医薬組成物。

〔41〕 高血圧症治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする上記〔25〕記載の医薬組成物。

〔42〕 高血圧症治療薬が、チアジド、アルドステロン拮抗剤、アドレナリン作動性ニューロン遮断薬、カルシウムチャネル遮断薬、ドーパミンD2拮抗剤、 β -アドレナリン受容体拮抗剤、 α 2-アドレナリン受容体作動剤、グアニル酸シクラーゼ活性化剤、 β 1-アドレナリン受容体拮抗剤、 α 1-アドレナリン受容体拮抗剤、抗酸化剤、アンギオテンシン-I
25 変換酵素（ACE）阻害剤、 Na^+/H^+ 交換阻害剤、 α -アドレナリン受容体拮抗剤、酸化窒素供与体、5-HT2拮抗剤、K(ATP)チャネル活性化剤、カリウム保持性利尿性プロスタグランジンシンターゼ刺激剤、イミダゾリンI1受
30

- 容体作動剤、アンギオテンシン AT1 拮抗剤、ドーパミン D1 作動剤、グアニル酸シクラーゼ刺激剤、エンドセリン ETA 受容体拮抗剤、エンドセリン ETB 受容体拮抗剤、NOS3 発現増強剤、プロスタサイクリンアナログ、プロスタグランジン、アンギオテンシン II 拮抗剤、電解質吸収作動剤、
- 5 ニコチン拮抗剤、ドーパミン D2 作動剤、プロラクチン阻害剤、血小板活性化因子 (PAF) 拮抗剤、血小板凝固拮抗剤、腫瘍壊死因子拮抗剤、Rho キナーゼ阻害剤、PPAR α 作動剤、AMPA 受容体調節剤、GABA (A) 受容体拮抗剤及びホスホジエステラーゼ V (PDE5A) 阻害剤からなる群より選択される 1 以上の薬剤である上記 [4 1] 記載の医薬組成物。
- 10 [4 3] 高血圧症治療薬が、クロロチアジド、ヒドロクロロチアジド、ヒドロフルメチアジド、メチクロチアジド、ポリチアジド、サイパミド、シクロペンチアジド、ベンドロフルメチアジド (ベンドロフルアジド)、スピロラクトン、エポキシメクスレノン (エプレレノン)、モノ硫酸グアネチジン、硫酸グアナドレル、ベラパミル、塩酸プロプラノロール、
- 15 塩酸アルプレノロール、ピンドロール、塩酸オクスプレノロール、マレイン酸チモロール、塩酸ソタロール、塩酸アセブトロール、塩酸カルテオロール、硫酸メピンドロール、塩酸アロチノロール、塩酸インデノロール、塩酸タータトロール、塩酸セリプロロール、塩酸チリソロール、ネビボロール、硫酸ペンブトロール、ナドロール、塩酸クロラノロール、
- 20 塩酸ペパントール (ペパントロール)、クロニジン、塩酸ゲアンファシン、塩酸ジルチアゼム、塩酸ニカルジピン、ニトレンジピン、フェロジピン、ニルバジピン、ニバジピン、ニソルジピン、塩酸ベニジピン、ベシル酸アムロジピン、塩酸フラニジピン (マニジピン)、ラシジピン、イスラジピン、塩酸バルニジピン (メピロジピン)、塩酸エホニジピン エタノー
- 25 ル、シナルジピン (シルニジピン)、アラニジピン、塩酸レルカニジピン (マスニジピン)、アゼルニジピン、アムロジピン、マニジピン (フラニジピン)、ニトロプルシドナトリウム、アテノロール、酒石酸メトプロロール、塩酸ベタキシノロール、ボピンドロール、フマル酸ビソプロロール、塩酸エスモロール、カルベジロール、コハク酸メトプロロール、タリノ
- 30 ロール、塩酸プラゾシン、ウラピジル、塩酸インドラミン、塩酸ブナゾシン、塩酸テラゾシン、メシル酸ドキサゾシン、ウラピジル、ニフェジピン、カプトプリル、マレイン酸エナラプリル、リシノプリル、ペリン

ドプリル、アラセプリル、ラミプリル、塩酸キナプリル、塩酸デラプリル、塩酸ベナゼプリル、シラザプリル、フォシノプリラート、フォシノプリルナトリウム、トランドラプリル、スピラプリル、塩酸テモカプリル、塩酸モエキシプリル、塩酸イミダプリル、ゾフェノプリルカルシウム、エナラプリラート、ゾフェノプリラート、塩酸アミロライド、塩酸ラベタロール、ニブラジロール（ニブラドロール）、リンシドミン、ケタンセリン、ピナシジル、シクレタニン（シクレタニド）、塩酸アモスラロール、塩酸モキシニジン水和物、ロサルタンカリウム、バルサルタン、メシル酸エプロサルタン、カンデサルタンシレキセチル（ヘキセチル）、
10 イルベサルタン、テルミサルタン、オルメサルタンメドキシミル、メシル酸フェノルドパム、カドララジン、リン酸二水素リルメニジン、ボセンタン、ベラプロストナトリウム、リマプロストアルファデックス（ α -シクロデキストリン）、ユニプロスト（トレプロスチニルナトリウム）、イロプロスト（シロプロスト）、塩酸メカミルアミン、メテルゴリン、酢
15 酸グアナベンズ、クロリクロメン、ファスジル、ドコネクセント（ドコサヘキサエン酸）、シクロチアジド、クエン酸シルデナフィル、クロルタリドン、キネタゾン、インダパミド、メトラゾン、塩酸フェノキシベンザミン、メチロシン、ジアゾキシド、トラセミド（トルセミド）、クロパミド、塩酸ヒドララジン、レセルピン及びメチルドパからなる群より選
20 択される 1 以上の薬剤である上記〔42〕記載の医薬組成物。

〔44〕 血栓症治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする上記〔25〕記載の医薬組成物。

〔45〕 血栓症治療薬が、ヘパリン製剤、低分子量ヘパリン、ヘパリンアナログ、抗凝固剤、トロンビン阻害剤、抗トロンビン製剤、抗血小板剤及び血栓溶解剤からなる群より選択される 1 以上の薬剤である上記
25 〔44〕記載の医薬組成物。

〔46〕 血栓症治療薬が、ヘパリンカルシウム、ヘパリンナトリウム、ダルテパリンナトリウム、パルナパリンナトリウム、レビパリンナトリウム、ダナパロイドナトリウム、ワルファリンカリウム、アルガトロバン、メシル酸ガベキセート、メシル酸ナファモスタット、ヒトアンチト
30 ロンビン III、アスピリン、ジピリダモール、塩酸チクロピジン、シロスタゾール、リマプロストアルファデックス、オザグレルナトリウム、塩

酸サルボグレラート、イコサペント酸エチル、ベラプロストナトリウム、ウロキナーゼ、チソキナーゼ、アルテプララーゼ、ナサルプララーゼ、ナテプララーゼ、モンテプララーゼ、パミテプララーゼ、バトロキソビン、クエン酸ナトリウム及びプロテインCからなる群より選択される1以上の薬剤
5 である上記〔45〕記載の医薬組成物。

〔47〕 高脂血症治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする上記〔28〕記載の糖尿病予防又は治療用医薬組成物。

〔48〕 高脂血症治療薬が、HMG-CoA レダクターゼ阻害剤(スタチン)、フィブラート、TNFSF6 発現阻害剤、HDL-コレステロール増加剤、アポ A1
10 発現増強剤、SPP1 (オステオポンチン) 発現阻害剤、ペルオキシソーム増殖因子活性化受容体 (PPAR) に作用する薬剤、PPAR α 作動剤、リパーゼ清澄化因子刺激剤、コレステロール拮抗剤、血小板凝固拮抗剤、抗酸化剤、コレステロール生合成阻害剤、LDL-受容体アップレギュレーター、胆汁酸封鎖剤、コレステロール吸収阻害剤及びニコチン酸からなる群よ
15 り選択される1以上の薬剤である上記〔47〕記載の糖尿病予防又は治療用医薬組成物。

〔49〕 高脂血症治療薬が、ロバスタチン、プラバスタチン (エプタスタチン) ナトリウム、フルバスタチン (フルインドスタイニン) ナトリウム、ロスバスタチンカルシウム、アトルバスタチンカルシウム、シン
20 パスタチン (シンビノリン)、ピタバスタチン (イタバスタチン、ニスバスタチン) カルシウム、ロニフィブラート (ロニフィブラート)、ビニフィブラート (ビニフィブラート)、クリノフィブラート、シプロフィブラート、クロフィブラート、エトフィブラート、フェノフィブラート、ベザフィブラート、ゲンフィプロジル、アシピモクス、エイコサペンタエ
25 ン酸 (イコサペント、イコペネート、イコサペント酸) エチルエステル、プロブコール、ポリコサノール、塩酸コレセベラム、コレステラミン (コレステラミン樹脂)、塩酸コレステポール、コレステミド (コレステラン)、エゼチミブ及びナイアシン (ニコチン酸) からなる群より選択される1以上の薬剤である上記〔48〕記載の糖尿病予防又は治療用医薬
30 組成物。

〔50〕 他の糖尿病治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする上記〔28〕記載の糖尿病予防又は治療用医薬組成物。

〔51〕 他の糖尿病治療薬が、インスリン分泌促進剤、ビグアナイド剤、 α -グルコシダーゼ阻害剤、インスリン製剤、インスリンアナログ、インスリン感受性増強剤、IL-11、抗-CD25 (IL-2 受容体) 剤、アンギオテンシン(AT1)拮抗剤、アンギオテンシン変換酵素 (ACE) 阻害剤、アルドースレダクターゼ阻害剤、抗酸化剤、カルニチンアセチルトランスフェラーゼ刺激剤、抗鬱剤、グルココルチコイド、レチリン、ラジカル形成作動剤及びトランスケトラーゼ活性化剤からなる群より選択される1以上の薬剤である上記〔50〕記載の糖尿病予防又は治療用医薬組成物。

〔52〕 他の糖尿病治療薬が、ナテグリニド、グリメピリド、グリベンクラミド、グリクラジド、アセトヘキサミド、トルブタミド、グリクロピラミド、トラザミド、グリブゾール、グリピジド、グルボルヌリド、グリキドン、レパグリニド、塩酸メトホルミン、塩酸ブホルミン、ボグリボース、アカルボース、エパルレストアット、ミグリトール、インスリン、塩酸ピオグリタゾン、マレイン酸ロシグリタゾン、ピコリン酸クロム/ビオチン、V-411、組換えヒトインターロイキン-11、ダシリキシマブ (ダシリツマブ)、ロサルタンカリウム、カプトプリル、塩酸イミダプリル、 α -リポ酸、塩酸レバセカルニン(アセチル-L-カルニチン、アセチルレボカルニチン)、カプトプリル、レチリン、ベルテポルフィン、ペンフォチアミン及びフルオシノロンアセトニドからなる群より選択される1以上の薬剤である上記〔51〕記載の糖尿病予防又は治療用医薬組成物。

〔53〕 肥満症治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする上記〔28〕記載の糖尿病予防又は治療用医薬組成物。

〔54〕 肥満症治療薬が、マジンドール、リパーゼ阻害剤、5-HT/ノルエピネフリン再取り込みデュアルインヒビター、5-HT 再取り込み阻害剤、ハーバルエフェドリン及びカフェインを含むサプリメント、ヒト絨毛性性腺刺激ホルモン、アドレナリン受容体作動剤、メタアンフェタミン、フェンタミン及びアムフェプラモンからなる群より選択される1以上の薬剤である上記〔53〕記載の糖尿病予防又は治療用医薬組成物。

〔55〕 肥満症治療薬が、マジンドール、オルリスタット、塩酸シブトラミン-水和物、塩酸フルオキセチン、絨毛性性腺刺激ホルモン (ヒト)、NCP システムを用いる VNS 療法、メタラミノール、塩酸 d-メタアンフェタミン、フェンテルミン、塩酸アムフェプラモン(ジエチルプロピオ

ン)、塩酸ベンズフェタミン及び酒石酸フェンジメトラジンからなる群より選択される1以上の薬剤である上記[54]記載の糖尿病予防又は治療用医薬組成物。

5 [56] 高血圧症治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする上記[28]記載の糖尿病予防又は治療用医薬組成物。

[57] 高血圧症治療薬が、チアジド、アルドステロン拮抗剤、アドレナリン作動性ニューロン遮断薬、カルシウムチャネル遮断薬、ドーパミン D2 拮抗剤、 β -アドレナリン受容体拮抗剤、 α 2-アドレナリン受容体作動剤、グアニル酸シクラーゼ活性化剤、 β 1-アドレナリン受容体拮抗剤、 α 1-アドレナリン受容体拮抗剤、抗酸化剤、アンギオテンシン-I 変換酵素 (ACE) 阻害剤、 Na^+/H^+ 交換阻害剤、 α -アドレナリン受容体拮抗剤、酸化窒素供与体、5-HT₂ 拮抗剤、K(ATP)チャネル活性化剤、カリウム保持性利尿性プロスタグランジンシンターゼ刺激剤、イミダゾリン I₁ 受容体作動剤、アンギオテンシン AT₁ 拮抗剤、ドーパミン D₁ 作動剤、グアニル酸シクラーゼ刺激剤、エンドセリン ETA 受容体拮抗剤、エンドセリン ET_B 受容体拮抗剤、NOS3 発現増強剤、プロスタサイクリンアナログ、プロスタグランジン、アンギオテンシン II 拮抗剤、電解質吸収作動剤、ニコチン拮抗剤、ドーパミン D₂ 作動剤、プロラクチン阻害剤、血小板活性化因子 (PAF) 拮抗剤、血小板凝固拮抗剤、腫瘍壊死因子拮抗剤、Rho キナーゼ阻害剤、PPAR α 作動剤、AMPA 受容体調節剤、GABA (A) 受容体拮抗剤及びホスホジエステラーゼ V (PDE5A) 阻害剤からなる群より選択される1以上の薬剤である上記[56]記載の糖尿病予防又は治療用医薬組成物。

[58] 高血圧症治療薬が、クロロチアジド、ヒドロクロロチアジド、ヒドロフルメチアジド、メチクロロチアジド、ポリチアジド、サイパミド、シクロペンチアジド、ベンドロフルメチアジド (ベンドロフルアジド)、スピロノラクトン、エポキシメクスレノン (エプレレノン)、モノ硫酸グアネチジン、硫酸グアナドレル、ベラパミル、塩酸プロプラノロール、塩酸アルブレノロール、ピンドロール、塩酸オクスプレノロール、マレイン酸チモロール、塩酸ソタロール、塩酸アセブトロール、塩酸カルテオロール、硫酸メピンドロール、塩酸アロチノロール、塩酸インデノロール、塩酸タータトロール、塩酸セリプロロール、塩酸チリソロール、ネビボロール、硫酸ペンブトロール、ナドロール、塩酸クロラノロール、

- 塩酸ベバントール (ベバントロール)、クロニジン、塩酸グアンファシン、
塩酸ジルチアゼム、塩酸ニカルジピン、ニトレンジピン、フェロジピン、
ニルバジピン、ニバジピン、ニソルジピン、塩酸ベニジピン、ベシル酸
5 アムロジピン、塩酸フラニジピン (マニジピン)、ラシジピン、イスラジ
ピン、塩酸バルニジピン (メピロジピン)、塩酸エホニジピン エタノー
ル、シナルジピン (シルニジピン)、アラニジピン、塩酸レルカニジピン
(マスニジピン)、アゼルニジピン、アムロジピン、マニジピン (フラニ
ジピン)、ニトロプルシドナトリウム、アテノロール、酒石酸メトプロロ
ール、塩酸ベタキソロール、ボピンドロール、フマル酸ビソプロロール、
10 塩酸エスモロール、カルベジロール、コハク酸メトプロロール、タリノ
ロール、塩酸プラゾシン、ウラピジル、塩酸インドラミン、塩酸ブナゾ
シン、塩酸テラゾシン、メシル酸ドキサゾシン、ウラピジル、ニフェジ
ピン、カプトプリル、マレイン酸エナラプリル、リシノプリル、ペリン
ドプリル、アラセプリル、ラミプリル、塩酸キナプリル、塩酸デラプリ
15 ル、塩酸ベナゼプリル、シラザプリル、フォシノプリラート、フォシノ
プリルナトリウム、トランドラプリル、スピラプリル、塩酸デモカプリ
ル、塩酸モエキシプリル、塩酸イミダプリル、ゾフェノプリルカルシウ
ム、エナラプリラート、ゾフェノプリラート、塩酸アミロライド、塩酸
ラベタロール、ニブラジロール (ニブラドロール)、リンシドミン、ケタ
20 ンセリン、ピナシジル、シクレタニン (シクレタニド)、塩酸アモスラロ
ール、塩酸モキシニジン水和物、ロサルタンカリウム、バルサルタン、
メシル酸エプロサルタン、カンデサルタンシレキセチル (ヘキセチル)、
イルベサルタン、テルミサルタン、オルメサルタンメドキシミル、メシ
ル酸フェノルドパム、カドララジン、リン酸二水素リルメニジン、ボセ
25 ンタン、ベラプロストナトリウム、リマプロストアルファデックス (α -
シクロデキストリン)、ユニプロスト (トレプロスチニルナトリウム)、
イロプロスト (シロプロスト)、塩酸メカミルアミン、メテルゴリン、酢
酸グアナベンズ、クロリクロメン、ファスジル、ドコネクセント (ドコ
サヘキサエン酸)、シクロチアジド、クエン酸シルデナフィル、クロルタ
30 リドン、キネタゾン、インダパミド、メトラゾン、塩酸フェノキシベン
ザミン、メチロシン、ジアゾキシド、トラセミド (トルセミド)、クロバ
ミド、塩酸ヒドララジン、レセルピン及びメチルドパからなる群より選

択される 1 以上の薬剤である上記 [5 7] 記載の糖尿病予防又は治療用医薬組成物。

[5 9] 血栓症治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする上記 [2 8] 記載の糖尿病予防又は治療用医薬組成物。

- 5 [6 0] 血栓症治療薬が、ヘパリン製剤、低分子量ヘパリン、ヘパリンアナログ、抗凝固剤、トロンビン阻害剤、抗トロンビン製剤、抗血小板剤及び血栓溶解剤からなる群より選択される 1 以上の薬剤である上記 [5 9] 記載の糖尿病予防又は治療用医薬組成物。

- [6 1] 血栓症治療薬が、ヘパリンカルシウム、ヘパリンナトリウム、
10 ダルテパリンナトリウム、パルナパリンナトリウム、レビパリンナトリウム、ダナパロイドナトリウム、ワルファリンカリウム、アルガトロバン、メシル酸ガベキセート、メシル酸ナファモスタット、ヒトアンチトロンビン III、アスピリン、ジピリダモール、塩酸チクロピジン、シロスタゾール、リマプロストアルファデックス、オザグレルナトリウム、塩
15 酸サルボグレラート、イコサペント酸エチル、ベラプロストナトリウム、ウロキナーゼ、チソキナーゼ、アルテプラナーゼ、ナサルプラナーゼ、ナテプラナーゼ、モンテプラナーゼ、パミテプラナーゼ、バトロキシピン、クエン酸ナトリウム及びプロテイン C からなる群より選択される 1 以上の薬剤である上記 [6 0] 記載の糖尿病予防又は治療用医薬組成物。

- 20 [6 2] 他の高脂血症治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする上記 [2 9] 記載の高脂血症予防又は治療用医薬組成物。

- [6 3] 他の高脂血症治療薬が、HMG-CoA レダクターゼ阻害剤(スタチン)、フィブラート、TNFSF6 発現阻害剤、HDL-コレステロール増加剤、アポ A1 発現増強剤、SPP1 (オステオポンチン) 発現阻害剤、ペルオキシソーム増殖因子活性化受容体 (PPAR) に作用する薬剤、PPAR α 作動剤、リパーゼ清澄化因子刺激剤、コレステロール拮抗剤、血小板凝固拮抗剤、抗酸化剤、コレステロール生合成阻害剤、LDL-受容体アップレギュレーター、胆汁酸封鎖剤、コレステロール吸収阻害剤及びニコチン酸からなる群より選択される 1 以上の薬剤である上記 [6 2] 記載の高脂血症予防
25 又は治療用医薬組成物。

[6 4] 他の高脂血症治療薬が、ロバスタチン、プラバスタチン (エプタスタチン) ナトリウム、フルバスタチン (フルインドスタイニン) ナ

トリウム、ロスバスタチンカルシウム、アトルバスタチンカルシウム、シンバスタチン（シンビノリン）、ピタバスタチン（イタバスタチン、ニスバスタチン）カルシウム、ロニフィブラート（ロニフィブラート）、ビニフィブラート（ビニフィブラート）、クリノフィブラート、シプロフィブラート、クロフィブラート、エトフィブラート、フェノフィブラート、ベザフィブラート、ゲンフィブロジル、アシピモクス、エイコサペンタエン酸（イコサペント、イコペネート、イコサペント酸）エチルエステル、プロブコール、ポリコサノール、塩酸コレセベラム、コレスチラミン（コレスチラミン樹脂）、塩酸コレスチポール、コレスチミド（コレスチラン）、エゼチミブ及びナイアシン（ニコチン酸）からなる群より選択される1以上の薬剤である上記〔63〕記載の高脂血症予防又は治療用医薬組成物。

〔65〕 糖尿病治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする上記〔29〕記載の高脂血症予防又は治療用医薬組成物。

〔66〕 糖尿病治療薬が、インスリン分泌促進剤、ビッグアニド剤、 α -グルコシダーゼ阻害剤、インスリン製剤、インスリンアナログ、インスリン感受性増強剤、IL-11、抗CD25（IL-2受容体）剤、アンギオテンシン（AT1）拮抗剤、アンギオテンシン変換酵素（ACE）阻害剤、アルドースレダクターゼ阻害剤、抗酸化剤、カルニチンアセチルトランスフェラーゼ刺激剤、抗鬱剤、グルココルチコイド、レチリン、ラジカル形成作動剤及びトランスケトラーゼ活性化剤からなる群より選択される1以上の薬剤である上記〔65〕記載の高脂血症予防又は治療用医薬組成物。

〔67〕 糖尿病治療薬が、ナテグリニド、グリメピリド、グリベンクラミド、グリクラジド、アセトヘキサミド、トルブタミド、グリクロピラミド、トラザミド、グリブゾール、グリピジド、グルボルヌリド、グリキドン、レパグリニド、塩酸メトホルミン、塩酸ブホルミン、ボグリボース、アカルボース、エパルレスタット、ミグリトール、インスリン、塩酸ピオグリタゾン、マレイン酸ロシグリタゾン、ピコリン酸クロム/ビオチン、V-411、組換えヒトインターロイキン-11、ダシリキシマブ（ダシリツマブ）、ロサルタンカリウム、カプトプリル、塩酸イミダプリル、 α -リポ酸、塩酸レバセカルニン（アセチル-L-カルニチン、アセチルレボカルニチン）、カプトプリル、レチリン、ベルテポルフィン、ベンフォチ

アミン及びフルオシノロンアセトニドからなる群より選択される 1 以上の薬剤である上記 [66] 記載の高脂血症予防又は治療用医薬組成物。

[68] 肥満症治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする上記 [29] 記載の高脂血症予防又は治療用医薬組成物。

- 5 [69] 肥満症治療薬が、マジンドール、リパーゼ阻害剤、5-HT/ノルエピネフリン再取り込みデュアルインヒビター、5-HT 再取り込み阻害剤、ハーバルエフェドリン及びカフェインを含むサプリメント、ヒト絨毛性性腺刺激ホルモン、アドレナリン受容体作動剤、メタアンフェタミン、フェンタミン及びアムフェプラモンからなる群より選択される 1 以上の薬剤である上記 [68] 記載の高脂血症予防又は治療用医薬組成物。

- 10 [70] 肥満症治療薬が、マジンドール、オルリスタット、塩酸シブトラミン—水和物、塩酸フルオキセチン、絨毛性性腺刺激ホルモン（ヒト）、NCP システムを用いる VNS 療法、メタラミノール、塩酸 d-メタアンフェタミン、フェンテルミン、塩酸アムフェプラモン（ジエチルプロピオン）、塩酸ベンズフェタミン及び酒石酸フェンジメトラジンからなる群より選択される 1 以上の薬剤である上記 [69] 記載の高脂血症予防又は治療用医薬組成物。

[71] 高血圧症治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする上記 [29] 記載の高脂血症予防又は治療用医薬組成物。

- 20 [72] 高血圧症治療薬が、チアジド、アルドステロン拮抗剤、アドレナリン作動性ニューロン遮断薬、カルシウムチャネル遮断薬、ドーパミン D2 拮抗剤、 β -アドレナリン受容体拮抗剤、 $\alpha 2$ -アドレナリン受容体作動剤、グアニル酸シクラーゼ活性化剤、 $\beta 1$ -アドレナリン受容体拮抗剤、 $\alpha 1$ -アドレナリン受容体拮抗剤、抗酸化剤、アンギオテンシン-I 変換酵素 (ACE) 阻害剤、 Na^+/H^+ 交換阻害剤、 α -アドレナリン受容体拮抗剤、酸化窒素供与体、5-HT₂ 拮抗剤、K(ATP)チャネル活性化剤、カリウム保持性利尿性プロスタグランジンシンターゼ刺激剤、イミダゾリン II 受容体作動剤、アンギオテンシン AT₁ 拮抗剤、ドーパミン D₁ 作動剤、グアニル酸シクラーゼ刺激剤、エンドセリン ETA 受容体拮抗剤、エンドセリン ETB 受容体拮抗剤、NOS3 発現増強剤、プロスタサイクリンアナログ、プロスタグランジン、アンギオテンシン II 拮抗剤、電解質吸収作動剤、ニコチン拮抗剤、ドーパミン D₂ 作動剤、プロラクチン阻害剤、血小板活
- 25
- 30

性化因子 (PAF) 拮抗剤、血小板凝固拮抗剤、腫瘍壊死因子拮抗剤、Rho キナーゼ阻害剤、PPAR α 作動剤、AMPA 受容体調節剤、GABA (A) 受容体拮抗剤及びホスホジエステラーゼ V (PDE5A) 阻害剤からなる群より選択される 1 以上の薬剤である上記 [71] 記載の高脂血症予防又は治療用医薬組成物。

[73] 高血圧症治療薬が、クロロチアジド、ヒドロクロロチアジド、ヒドロフルメチアジド、メチクロチアジド、ポリチアジド、サイパミド、シクロペンチアジド、ベンドロフルメチアジド (ベンドロフルアジド)、スピロノラクトン、エポキシメクスレノン (エプレレノン)、モノ硫酸グ
10 アネチジン、硫酸グアナドレル、ベラパミル、塩酸プロプラノロール、塩酸アルプレノロール、ピンドロール、塩酸オクスプレノロール、マレイン酸チモロール、塩酸ソタロール、塩酸アセブトロール、塩酸カルテオロール、硫酸メピンドロール、塩酸アロチノロール、塩酸インデノ
15 ネピボロール、硫酸ペンブトロール、ナドロール、塩酸クロラノロール、塩酸ベバントール (ベバントロール)、クロニジン、塩酸グアンファシン、塩酸ジルチアゼム、塩酸ニカルジピン、ニトレンジピン、フェロジピン、ニルバジピン、ニバジピン、ニソルジピン、塩酸ベニジピン、ベシル酸
20 アムロジピン、塩酸フラニジピン (マニジピン)、ラシジピン、イスラジピン、塩酸バルニジピン (メピロジピン)、塩酸エホニジピン エタノール、シナルジピン (シルニジピン)、アラニジピン、塩酸レルカニジピン (マスニジピン)、アゼルニジピン、アムロジピン、マニジピン (フラニ
25 ジピン)、ニトロプルシドナトリウム、アテノロール、酒石酸メトプロロール、塩酸ベタキシロール、ボピンドロール、フマル酸ビソプロロール、塩酸エスモロール、カルベジロール、コハク酸メトプロロール、タリノ
30 ロール、塩酸プラゾシン、ウラピジル、塩酸インドラミン、塩酸ブナゾシン、塩酸テラゾシン、メシル酸ドキサゾシン、ウラピジル、ニフェジピン、カプトプリル、マレイン酸エナラプリル、リシノプリル、ペリンドプリル、アラセプリル、ラミプリル、塩酸キナプリル、塩酸デラプリル、塩酸ベナゼプリル、シラザプリル、フォシノプリラート、フォシノ
35 プリルナトリウム、トランドラプリル、スピラプリル、塩酸テモカプリル、塩酸モエキシプリル、塩酸イミダプリル、ゾフェノプリルカルシウム

- ム、エナラプリラート、ゾフェノプリラート、塩酸アミロライド、塩酸ラベタロール、ニプラジロール（ニプラドロール）、リンシドミン、ケタンセリン、ピナシジル、シクレタニン（シクレタニド）、塩酸アモスラロール、塩酸モキシソニジン水和物、ロサルタンカリウム、バルサルタン、
- 5 メシル酸エプロサルタン、カンデサルタンシレキセチル（ヘキセチル）、イルベサルタン、テルミサルタン、オルメサルタンメドキシミル、メシル酸フェノルドパム、カドララジン、リン酸二水素リルメニジン、ボセンタン、ベラプロストナトリウム、リマプロストアルファデックス（ α -シクロデキストリン）、ユニプロスト（トレプロスチニルナトリウム）、
- 10 イロプロスト（シロプロスト）、塩酸メカミルアミン、メテルゴリン、酢酸グアナベンズ、クロリクロメン、ファスジル、ドコネクセント（ドコサヘキサエン酸）、シクロチアジド、クエン酸シルデナフィル、クロルタリドン、キネタゾン、インダパミド、メトラゾン、塩酸フェノキシベンザミン、メチロシン、ジアゾキシド、トラセミド（トルセミド）、クロパ
- 15 ミド、塩酸ヒドララジン、レセルピン及びメチルドパからなる群より選択される1以上の薬剤である上記〔72〕記載の高脂血症予防又は治療用医薬組成物。

〔74〕 血栓症治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする上記〔29〕記載の高脂血症予防又は治療用医薬組成物。

- 20 〔75〕 血栓症治療薬が、ヘパリン製剤、低分子量ヘパリン、ヘパリンアナログ、抗凝固剤、トロンビン阻害剤、抗トロンビン製剤、抗血小板剤及び血栓溶解剤からなる群より選択される1以上の薬剤である上記〔74〕記載の高脂血症予防又は治療用医薬組成物。

- 〔76〕 血栓症治療薬が、ヘパリンカルシウム、ヘパリンナトリウム、
- 25 ダルテパリンナトリウム、パルナパリンナトリウム、レビパリンナトリウム、ダナパロイドナトリウム、ワルファリンカリウム、アルガトロバン、メシル酸ガベキセート、メシル酸ナファモスタット、ヒトアンチトロンビン III、アスピリン、ジピリダモール、塩酸チクロピジン、シロスタゾール、リマプロストアルファデックス、オザグレレルナトリウム、塩
- 30 酸サルボグレラート、イコサペント酸エチル、ベラプロストナトリウム、ウロキナーゼ、チソキナーゼ、アルテプラナーゼ、ナサルプラナーゼ、ナテプラナーゼ、モンテプラナーゼ、パミテプラナーゼ、パトロキシビン、クエン

酸ナトリウム及びプロテインCからなる群より選択される1以上の薬剤である上記[75]記載の高脂血症予防又は治療用医薬組成物。

[77] 高脂血症治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする上記[30]記載の肥満症予防又は治療用医薬組成物。

- 5 [78] 高脂血症治療薬が、HMG-CoA レダクターゼ阻害剤(スタチン)、フィブラート、TNFSF6 発現阻害剤、HDL-コレステロール増加剤、アポ A1 発現増強剤、SPP1 (オステオポンチン) 発現阻害剤、ペルオキシソーム増殖因子活性化受容体 (PPAR) に作用する薬剤、PPAR α 作動剤、リパーゼ清澄化因子刺激剤、コレステロール拮抗剤、血小板凝固拮抗剤、抗酸化剤、コレステロール生合成阻害剤、LDL-受容体アップレギュレーター、胆汁酸封鎖剤、コレステロール吸収阻害剤及びニコチン酸からなる群より選択される1以上の薬剤である上記[77]記載の肥満症予防又は治療用医薬組成物。

- 15 [79] 高脂血症治療薬が、ロバスタチン、プラバスタチン (エプタスタチン) ナトリウム、フルバスタチン (フルインドスタイニン) ナトリウム、ロスバスタチンカルシウム、アトルバスタチンカルシウム、シンバスタチン (シンピノリン)、ピダバスタチン (イダバスタチン、ニスバスタチン) カルシウム、ロニフィブラート (ロニフィブラート)、ビニフィブラート (ビニフィブラート)、クリノフィブラート、シプロフィブラート、クロフィブラート、エトフィブラート、フェノフィブラート、ベザフィブラート、ゲンフィプロジル、アシピモクス、エイコサペンタエン酸 (イコサペント、イコペネート、イコサペント酸) エチルエステル、プロブコール、ポリコサノール、塩酸コレセペラム、コレスチラミン (コレスチラミン樹脂)、塩酸コレスチポール、コレスチミド (コレスチラン)、エゼチミブ及びナイアシン (ニコチン酸) からなる群より選択される1以上の薬剤である上記[78]記載の肥満症予防又は治療用医薬組成物。

[80] 糖尿病治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする上記[30]記載の肥満症予防又は治療用医薬組成物。

- 30 [81] 糖尿病治療薬が、インスリン分泌促進剤、ビッグアニド剤、 α グルコシダーゼ阻害剤、インスリン製剤、インスリンアナログ、インスリン感受性増強剤、IL-11、抗 CD25 (IL-2 受容体) 剤、アンギオテン

シン(AT1)拮抗剤、アンギオテンシン変換酵素 (ACE)阻害剤、アルドースレダクターゼ阻害剤、抗酸化剤、カルニチンアセチルトランスフェラーゼ刺激剤、抗鬱剤、グルココルチコイド、レチリン、ラジカル形成作動剤及びトランスケトラーゼ活性化剤からなる群より選択される1以上の

5 薬剤である上記〔80〕記載の肥満症予防又は治療用医薬組成物。

〔82〕 糖尿病治療薬が、ナテグリニド、グリメピリド、グリベンクラミド、グリクラジド、アセトヘキサミド、トルブタミド、グリクロピラミド、トラザミド、グリブゾール、グリピジド、グルボルヌリド、グリキドン、レパグリニド、塩酸メトホルミン、塩酸ブホルミン、ボグリ
10 ボース、アカルボース、エパルレストアット、ミグリトール、インスリン、塩酸ピオグリタゾン、マレイン酸ロシグリタゾン、ピコリン酸クロム/ビオチン、V-411、組換えヒトインターロイキン-11、ダシリキシマブ (ダシリツマブ)、ロサルタンカリウム、カプトプリル、塩酸イミダプリル、 α -リポ酸、塩酸レバセカルニン(アセチル-L-カルニチン、アセチルレボ
15 カルニチン)、カプトプリル、レチリン、ベルテボルフイン、ベンフォチアミン及びフルオシノロンアセトニドからなる群より選択される1以上の薬剤である上記〔81〕記載の肥満症予防又は治療用医薬組成物。

〔83〕 他の肥満症治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする上記〔30〕記載の肥満症予防又は治療用医薬組成物。

〔84〕 他の肥満症治療薬が、マジンドール、リパーゼ阻害剤、5-HT/ノルエピネフリン再取り込みデュアルインヒビター、5-HT 再取り込み阻
20 害剤、ハーバルエフェドリン及びカフェインを含むサプリメント、ヒト絨毛性性腺刺激ホルモン、アドレナリン受容体作動剤、メタアンフェタミン、フェンタミン及びアムフェプラモンからなる群より選択される1
25 以上の薬剤である上記〔83〕記載の肥満症予防又は治療用医薬組成物。

〔85〕 他の肥満症治療薬が、マジンドール、オルリスタット、塩酸シブトラミン-水和物、塩酸フルオキセチン、絨毛性性腺刺激ホルモン(ヒト)、NCP システムを用いる VNS 療法、メタラミノール、塩酸 d-メタ
30 アンフェタミン、フェンテルミン、塩酸アムフェプラモン(ジエチルプロピオン)、塩酸ベンズフェタミン及び酒石酸フェンジメトラジンからなる群より選択される1以上の薬剤である上記〔84〕記載の肥満症予防又は治療用医薬組成物。

〔 8 6 〕 高血圧症治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする上記〔 3 0 〕記載の肥満症予防又は治療用医薬組成物。

- 〔 8 7 〕 高血圧症治療薬が、チアジド、アルドステロン拮抗剤、アドレナリン作動性ニューロン遮断薬、カルシウムチャネル遮断薬、ドーパミン D2 拮抗剤、 β -アドレナリン受容体拮抗剤、 $\alpha 2$ -アドレナリン受容体作動剤、グアニル酸シクラーゼ活性化剤、 $\beta 1$ -アドレナリン受容体拮抗剤、 $\alpha 1$ -アドレナリン受容体拮抗剤、抗酸化剤、アンギオテンシン-I 変換酵素 (ACE) 阻害剤、 Na^+/H^+ 交換阻害剤、 α -アドレナリン受容体拮抗剤、酸化窒素供与体、5-HT₂ 拮抗剤、K(ATP)チャネル活性化剤、カリウム保持性利尿性プロスタグランジンシンターゼ刺激剤、イミダゾリン I₁ 受容体作動剤、アンギオテンシン AT₁ 拮抗剤、ドーパミン D₁ 作動剤、グアニル酸シクラーゼ刺激剤、エンドセリン ETA 受容体拮抗剤、エンドセリン ETB 受容体拮抗剤、NOS3 発現増強剤、プロスタサイクリンアナログ、プロスタグランジン、アンギオテンシン II 拮抗剤、電解質吸収作動剤、ニコチン拮抗剤、ドーパミン D₂ 作動剤、プロラクチン阻害剤、血小板活性化因子 (PAF) 拮抗剤、血小板凝固拮抗剤、腫瘍壊死因子拮抗剤、Rho キナーゼ阻害剤、PPAR α 作動剤、AMPA 受容体調節剤、GABA(A) 受容体拮抗剤及びホスホジエステラーゼ V (PDE5A) 阻害剤からなる群より選択される 1 以上の薬剤である上記〔 8 6 〕記載の肥満症予防又は治療用医薬組成物。
- 〔 8 8 〕 高血圧症治療薬が、クロロチアジド、ヒドロクロロチアジド、ヒドロフルメチアジド、メチクロチアジド、ポリチアジド、サイパミド、シクロペンチアジド、ベンドロフルメチアジド (ベンドロフルアジド)、スピロノラクトン、エポキシメクスレノン (エプレレノン)、モノ硫酸グアネチジン、硫酸グアナドレル、ベラパミル、塩酸プロプラノロール、塩酸アルプレノロール、ピンドロール、塩酸オクスプレノロール、マレイン酸チモロール、塩酸ソタロール、塩酸アセブトロール、塩酸カルテオロール、硫酸メピンドロール、塩酸アロチノロール、塩酸インデノロール、塩酸タータトロール、塩酸セリプロロール、塩酸チリソロール、ネビボロール、硫酸ペンブトロール、ナドロール、塩酸クロラノロール、塩酸ベバントール (ベバントロール)、クロニジン、塩酸グアンファシン、塩酸ジルチアゼム、塩酸ニカルジピン、ニトレンジピン、フェロジピン、ニルバジピン、ニバジピン、ニソルジピン、塩酸ベニジピン、ベシル酸

アムロジピン、塩酸フラニジピン (マニジピン)、ラシジピン、イスラジ
ピン、塩酸バルニジピン (メピロジピン)、塩酸エホニジピン エタノー
ル、シナルジピン (シルニジピン)、アラニジピン、塩酸レルカニジピン
(マスニジピン)、アゼルニジピン、アムロジピン、マニジピン (フラニ
5 ジピン)、ニトロプルシドナトリウム、アテノロール、酒石酸メトプロロ
ール、塩酸ベタキソロール、ボピンドロール、フマル酸ビソプロロール、
塩酸エスモロール、カルベジロール、コハク酸メトプロロール、タリノ
ロール、塩酸プラゾシン、ウラピジル、塩酸インドラミン、塩酸ブナゾ
シン、塩酸テラゾシン、メシル酸ドキサゾシン、ウラピジル、ニフェジ
10 ピン、カプトプリル、マレイン酸エナラプリル、リシノプリル、ペリン
ドプリル、アラセプリル、ラミプリル、塩酸キナプリル、塩酸デラプリ
ル、塩酸ベナゼプリル、シラザプリル、フォシノプリラート、フォシノ
プリルナトリウム、トランドラプリル、スピラプリル、塩酸テモカプリ
ル、塩酸モエキシプリル、塩酸イミダプリル、ゾフェノプリルカルシウ
15 ム、エナラプリラート、ゾフェノプリラート、塩酸アミロライド、塩酸
ラベテロール、ニプラジロール (ニプラドロール)、リンシドミン、ケタ
ンセリン、ピナシジル、シクレタニン (シクレタニド)、塩酸アモスラロ
ール、塩酸モキシニジン水和物、ロサルタンカリウム、バルサルタン、
メシル酸エプロサルタン、カンデサルタンシレキセチル (ヘキセチル)、
20 イルベサルタン、テルミサルタン、オルメサルタンメドキシミル、メシ
ル酸フェノルドパム、カドララジン、リン酸二水素リルメニジン、ボセ
ンタン、ベラプロストナトリウム、リマプロストアルファデックス (α -
シクロデキストリン)、ユニプロスト (トレプロスチニルナトリウム)、
イロプロスト (シロプロスト)、塩酸メカミルアミン、メテルゴリン、酢
25 酸グアナベンズ、クロリクロメン、ファスジル、ドコネクセント (ドコ
サヘキサエン酸)、シクロチアジド、クエン酸シルデナフィル、クロルタ
リドン、キネタゾン、インダパミド、メトラゾン、塩酸フェノキシベン
ザミン、メチロシン、ジアゾキシド、トラセミド (トルセミド)、クロパ
ミド、塩酸ヒドララジン、レセルピン及びメチルドパからなる群より選
30 択される 1 以上の薬剤である上記 [87] 記載の肥満症予防又は治療用
医薬組成物。

[89] 血栓症治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする上記

[30] 記載の肥満症予防又は治療用医薬組成物。

[90] 血栓症治療薬が、ヘパリン製剤、低分子量ヘパリン、ヘパリンアナログ、抗凝固剤、トロンビン阻害剤、抗トロンビン製剤、抗血小板剤及び血栓溶解剤からなる群より選択される1以上の薬剤である上記

5 [89] 記載の肥満症予防又は治療用医薬組成物。

[91] 血栓症治療薬が、ヘパリンカルシウム、ヘパリンナトリウム、ダルテパリンナトリウム、パルナパリンナトリウム、レビパリンナトリウム、ダナパロイドナトリウム、ワルファリンカリウム、アルガトロバン、メシル酸ガベキセート、メシル酸ナファモスタット、ヒトアンチトロンビン III、アスピリン、ジピリダモール、塩酸チクロピジン、シロスタゾール、リマプロストアルファデックス、オザグレルナトリウム、塩酸サルボグレラート、イコサペント酸エチル、ベラプロストナトリウム、ウロキナーゼ、チソキナーゼ、アルテプラゼ、ナサルプラゼ、ナテプラゼ、モンテプラゼ、パミテプラゼ、バトロキソビン、クエン酸ナトリウム及びプロテインCからなる群より選択される1以上の薬剤である上記 [90] 記載の肥満症予防又は治療用医薬組成物。

10

15

[92] 高脂血症治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする上記 [31] 記載の糖尿病合併症予防又は治療用医薬組成物。

[93] 高脂血症治療薬が、HMG-CoA レダクターゼ阻害剤(スタチン)、フィbrate、TNFSF6 発現阻害剤、HDL-コレステロール増加剤、アポ A1 発現増強剤、SPP1 (オステオポンチン) 発現阻害剤、ペルオキシソーム増殖因子活性化受容体 (PPAR) に作用する薬剤、PPAR α 作動剤、リパーゼ清澄化因子刺激剤、コレステロール拮抗剤、血小板凝固拮抗剤、抗酸化剤、コレステロール生合成阻害剤、LDL-受容体アップレギュレーター、胆汁酸封鎖剤、コレステロール吸収阻害剤及びニコチン酸からなる群より選択される1以上の薬剤である上記 [92] 記載の糖尿病合併症予防又は治療用医薬組成物。

20

25

[94] 高脂血症治療薬が、ロバスタチン、プラバスタチン (エプタスタチン)ナトリウム、フルバスタチン (フルインドスタイニン)ナトリウム、ロスバスタチンカルシウム、アトルバスタチンカルシウム、シンバスタチン (シンビノリン)、ピタバスタチン (イタバスタチン、ニスバスタチン) カルシウム、ロニフィbrate (ロニフィbrate)、ビニフ

30

- イブラート（ビニフィブラート）、クリノフィブラート、シプロフィブラート、クロフィブラート、エトフィブラート、フェノフィブラート、ベザフィブラート、ゲンフィブロジル、アシピモクス、エイコサペンタエン酸（イコサペント、イコペネート、イコサペント酸）エチルエステル、
- 5 プロブコール、ポリコサノール、塩酸コレセベラム、コレステラミン（コレステラミン樹脂）、塩酸コレステポール、コレステミド（コレステラン）、エゼチミブ及びナイアシン（ニコチン酸）からなる群より選択される 1 以上の薬剤である上記 [9 3] 記載の糖尿病合併症予防又は治療用医薬組成物。
- 10 [9 5] 糖尿病治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする上記 [3 1] 記載の糖尿病合併症予防又は治療用医薬組成物。
- [9 6] 糖尿病治療薬が、インスリン分泌促進剤、ビッグアニド剤、 α -グルコシダーゼ阻害剤、インスリン製剤、インスリンアナログ、インスリン感受性増強剤、IL-11、抗 CD25（IL-2 受容体）剤、アンギオテン
- 15 シン(AT1)拮抗剤、アンギオテンシン変換酵素（ACE）阻害剤、アルドースレダクターゼ阻害剤、抗酸化剤、カルニチンアセチルトランスフェラーゼ刺激剤、抗鬱剤、グルココルチコイド、レチリン、ラジカル形成作動剤及びトランスケトラーゼ活性化剤からなる群より選択される 1 以上の薬剤である上記 [9 5] 記載の糖尿病合併症予防又は治療用医薬組成物。
- 20 [9 7] 糖尿病治療薬が、ナテグリニド、グリメピリド、グリベンゲラミド、グリクラジド、アセトヘキサミド、トルブタミド、グリクロピラミド、トラザミド、グリブゾール、グリピジド、グルボルヌリド、グリキドン、レパグリニド、塩酸メトホルミン、塩酸ブホルミン、ボグリボース、アカルボース、エパルレスタット、ミグリトール、インスリン、
- 25 塩酸ピオグリタゾン、マレイン酸ロシグリタゾン、ピコリン酸クロム/ビオチン、V-411、組換えヒトインターロイキン-11、ダシリキシマブ（ダシリツマブ）、ロサルタンカリウム、カプトプリル、塩酸イミダプリル、 α -リボ酸、塩酸レバセカルニン（アセチル-L-カルニチン、アセチルレボカルニチン）、カプトプリル、レチリン、ベルテポルフィン、ベンフォチ
- 30 アミン及びフルオシノロンアセトニドからなる群より選択される 1 以上の薬剤である上記 [9 6] 記載の糖尿病合併症予防又は治療用医薬組成物。

[9 8] 肥満症治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする上記
[3 1] 記載の糖尿病合併症予防又は治療用医薬組成物。

[9 9] 肥満症治療薬が、マジンドール、リパーゼ阻害剤、5-HT/ノル
エピネフリン再取り込みデュアルインヒビター、5-HT 再取り込み阻害剤、
5 ハーバルエフェドリン及びカフェインを含むサプリメント、ヒト絨毛性
性腺刺激ホルモン、アドレナリン受容体作動剤、メタアンフェタミン、
フェンタミン及びアムフェプラモンからなる群より選択される1以上の
薬剤である上記 [9 8] 記載の糖尿病合併症予防又は治療用医薬組成物。

[1 0 0] 肥満症治療薬が、マジンドール、オルリスタット、塩酸シ
10 ブトラミンー水和物、塩酸フルオキセチン、絨毛性性腺刺激ホルモン
(ヒト)、NCP システムを用いる VNS 療法、メタラミノール、塩酸 d-メタ
アンフェタミン、フェンテルミン、塩酸アムフェプラモン(ジエチルプロ
ピオン)、塩酸ベンズフェタミン及び酒石酸フェンジメトラジンからなる
群より選択される1以上の薬剤である上記 [9 9] 記載の糖尿病合併症
15 予防又は治療用医薬組成物。

[1 0 1] 高血圧症治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする
上記 [3 1] 記載の糖尿病合併症予防又は治療用医薬組成物。

[1 0 2] 高血圧症治療薬が、チアジド、アルドステロン拮抗剤、ア
ドレナリン作動性ニューロン遮断薬、カルシウムチャネル遮断薬、ドー
20 パミン D2 拮抗剤、 β -アドレナリン受容体拮抗剤、 α 2-アドレナリン受
容体作動剤、グアニル酸シクラーゼ活性化剤、 β 1-アドレナリン受容体
拮抗剤、 α 1-アドレナリン受容体拮抗剤、抗酸化剤、アンギオテンシン-
I 変換酵素 (ACE) 阻害剤、 Na^+/H^+ 交換阻害剤、 α -アドレナリン受容体拮抗
剤、酸化窒素供与体、5-HT₂ 拮抗剤、K(ATP)チャネル活性化剤、カリウム
25 保持性利尿性プロスタグランジンシンターゼ刺激剤、イミダゾリン I₁ 受
容体作動剤、アンギオテンシン AT₁ 拮抗剤、ドーパミン D₁ 作動剤、グア
ニル酸シクラーゼ刺激剤、エンドセリン ETA 受容体拮抗剤、エンドセリ
ン ETB 受容体拮抗剤、NOS3 発現増強剤、プロスタサイクリンアナログ、
プロスタグランジン、アンギオテンシン II 拮抗剤、電解質吸収作動剤、
30 ニコチン拮抗剤、ドーパミン D₂ 作動剤、プロラクチン阻害剤、血小板活
性化因子 (PAF) 拮抗剤、血小板凝固拮抗剤、腫瘍壊死因子拮抗剤、Rho キ
ナーゼ阻害剤、PPAR α 作動剤、AMPA 受容体調節剤、GABA(A) 受容体拮抗剤

及びホスホジエステラーゼ V (PDE5A)阻害剤からなる群より選択される 1 以上の薬剤である上記 [101] 記載の糖尿病合併症予防又は治療用医薬組成物。

- [103] 高血圧症治療薬が、クロロチアジド、ヒドロクロロチアジド、ヒドロフルメチアジド、メチクロチアジド、ポリチアジド、サイパミド、シクロペンチアジド、ベンドロフルメチアジド (ベンドロフルアジド)、スピロノラクトン、エポキシメクスレノン (エプレレノン)、モノ硫酸グアネチジン、硫酸グアナドレル、ベラパミル、塩酸プロプラノロール、塩酸アルブレノロール、ピンドロール、塩酸オクスプレノロール、マレイン酸チモロール、塩酸ソタロール、塩酸アセプトロール、塩酸カルテオロール、硫酸メピンドロール、塩酸アロチノロール、塩酸インデノロール、塩酸タータトロール、塩酸セリプロロール、塩酸チリソロール、ネビボロール、硫酸ペンブトロール、ナドロール、塩酸クロラノロール、塩酸ベバントール (ベバントロール)、クロニジン、塩酸グアンファシン、塩酸ジルチアゼム、塩酸ニカルジピン、ニトレンジピン、フェロジピン、ニルバジピン、ニバジピン、ニソルジピン、塩酸ベニジピン、ベシル酸アムロジピン、塩酸フラニジピン (マニジピン)、ラシジピン、イスラジピン、塩酸バルニジピン (メピロジピン)、塩酸エホニジピン、エタノール、シナルジピン (シルニジピン)、アラニジピン、塩酸レルカニジピン (マスニジピン)、アゼルニジピン、アムロジピン、マニジピン (フラニジピン)、ニトロプルシドナトリウム、アテノロール、酒石酸メトプロロール、塩酸ベタキソロール、ボピンドロール、フマル酸ピソプロロール、塩酸エスモロール、カルベジロール、コハク酸メトプロロール、タリノロール、塩酸プラゾシン、ウラピジル、塩酸インドラミン、塩酸ブナゾシン、塩酸テラゾシン、メシル酸ドキサゾシン、ウラピジル、ニフェジピン、カプトプリル、マレイン酸エナラプリル、リシノプリル、ペリンドプリル、アラセプリル、ラミプリル、塩酸キナプリル、塩酸デラプリル、塩酸ベナゼプリル、シラザプリル、フォシノプリラート、フォシノプリルナトリウム、トランドラプリル、スピラプリル、塩酸テモカプリル、塩酸モエキシプリル、塩酸イミダプリル、ゾフェノプリルカルシウム、エナラプリラート、ゾフェノプリラート、塩酸アミロライド、塩酸ラベタロール、ニブラジロール (ニブラドロール)、リン

シドミン、ケタンセリン、ピナシジル、シクレタニン（シクレタニド）、
塩酸アモスラロール、塩酸モキシニジン水和物、ロサルタンカリウム、
バルサルタン、メシル酸エプロサルタン、カンデサルタンシレキセチル
(ヘキセチル)、イルベサルタン、テルミサルタン、オルメサルタンメド
5 キソミル、メシル酸フェノルドパム、カドララジン、リン酸二水素リル
メニジン、ボセンタン、ベラプロストナトリウム、リマプロストアルフ
ァデックス (α -シクロデキストリン)、ユニプロスト (トレプロスチニ
ルナトリウム)、イロプロスト (シロプロスト)、塩酸メカミルアミン、
メテルゴリン、酢酸グアナベンズ、クロリクロメン、ファスジル、ドコ
10 ネクセント (ドコサヘキサエン酸)、シクロチアジド、クエン酸シルデナ
フィル、クロルタリドン、キネタゾン、インダパミド、メトラゾン、塩
酸フェノキシベンザミン、メチロシン、ジアゾキシド、トラセミド (ト
ルセミド)、クロパミド、塩酸ヒドララジン、レセルピン及びメチルドパ
15 尿病合併症予防又は治療用医薬組成物。

[104] 血栓症治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする上
記 [31] 記載の糖尿病合併症予防又は治療用医薬組成物。

[105] 血栓症治療薬が、ヘパリン製剤、低分子量ヘパリン、ヘパ
リンアナログ、抗凝固剤、トロンビン阻害剤、抗トロンビン製剤、抗血
20 小板剤及び血栓溶解剤からなる群より選択される1以上の薬剤である上
記 [104] 記載の糖尿病合併症予防又は治療用医薬組成物。

[106] 血栓症治療薬が、ヘパリンカルシウム、ヘパリンナトリウ
ム、ダルテパリンナトリウム、パルナパリンナトリウム、レビパリンナ
トリウム、ダナパロイドナトリウム、ワルファリンカリウム、アルガト
25 ロバン、メシル酸ガベキセート、メシル酸ナファモスタット、ヒトアン
チトロンビン III、アスピリン、ジピリダモール、塩酸チクロピジン、シ
ロスタゾール、リマプロストアルファデックス、オザグレルナトリウム、
塩酸サルボグレラート、イコサペント酸エチル、ベラプロストナトリウ
ム、ウロキナーゼ、チソキナーゼ、アルテプラザーゼ、ナサルプラザーゼ、
30 ナテプラザーゼ、モンテプラザーゼ、パミテプラザーゼ、バトロキソビン、ク
エン酸ナトリウム及びプロテインCからなる群より選択される1以上の
薬剤である上記 [105] 記載の糖尿病合併症予防又は治療用医薬組成

物。

[107] 高脂血症治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする受容体型チロシンキナーゼネガティブ調節因子阻害用医薬組成物。

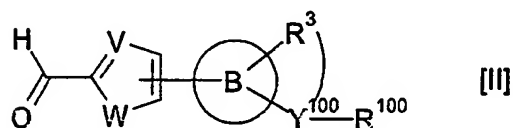
[108] 糖尿病治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする受容体型チロシンキナーゼネガティブ調節因子阻害用医薬組成物。

[109] 肥満症治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする受容体型チロシンキナーゼネガティブ調節因子阻害用医薬組成物。

[110] 高血圧症治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする受容体型チロシンキナーゼネガティブ調節因子阻害用医薬組成物。

10 [111] 血栓症治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする受容体型チロシンキナーゼネガティブ調節因子阻害用医薬組成物。

[112] 一般式 [I I]



〔式中、

15 Y^{100} は $-C(R^{13})(R^{14})-$ (R^{13} 及び R^{14} は、それぞれ、上記 [1] に記載の通りである。) を示し；

R^{100} は、水酸基又はハロゲン原子を示し；

V、W 及び R^2 は、それぞれ、上記 [1] に記載の通りである。) で示される複素芳香 5 員環化合物又はその医薬上許容し得る塩。

20 [113] 一般式 [I I] において、 R^{13} 及び R^{14} はそれぞれ水素原子を示し、V は $=CH-$ を示し、W は $-S-$ を示す上記 [112] 記載の複素芳香 5 員環化合物又はその医薬上許容し得る塩。

本明細書において使用する各置換基及び各部位の定義は、次の通りである。

25 「ハロゲン原子」とは、フッ素原子、塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子であり、好ましくはフッ素原子又は塩素原子である。

「 C_{1-4} アルキル基」とは、炭素数 1 乃至 4 の直鎖又は分岐鎖アルキル基を表し、具体的にはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基

30 が挙げられる。

好ましくは、 R^1 、 R^2 においてメチル基であり、 R^{13} 、 R^{14} 、 R^{19} 、 R^{22} 、 R^{25} においてメチル基、エチル基である。

「 C_{1-6} アルキル基」とは、炭素数 1 乃至 6 の直鎖又は分岐鎖アルキル基を表し、具体的にはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、*sec*-ブチル基、*tert*-ブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、ネオペンチル基、*tert*-ペンチル基、1-エチルプロピル基、ヘキシル基等が挙げられる。好ましくは、メチル基、エチル基又は炭素数 3 乃至 6 の分岐鎖アルキル基（例えば、イソプロピル基、イソブチル基、*tert*-ブチル基、イソペンチル基、ネオペンチル基、*tert*-ペンチル基、1-エチルプロピル基等）である。

好ましくは、 R^4 においてメチル基、エチル基、イソペンチル基であり、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} においてメチル基、イソブチル基であり、 R^{15} 、 R^{16} においてメチル基、エチル基、イソプロピル基であり、 R^{17} においてメチル基、イソブチル基であり、 R^{20} 、 R^{21} においてメチル基、イソペンチル基であり、 R^{22} 、 R^{23} 、 R^{24} においてメチル基、イソブチル基、*tert*-ブチル基、イソペンチル基、ネオペンチル基、*tert*-ペンチル基、1-エチルプロピル基である。

「 C_{1-8} アルキル基」とは、炭素数 1 乃至 8 の直鎖又は分岐鎖アルキル基を表し、具体的にはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、*sec*-ブチル基、*tert*-ブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、ネオペンチル基、*tert*-ペンチル基、1-エチルプロピル基、ヘキシル基、2-エチルブチル基、3, 3-ジメチルブチル基、ヘプチル基、1-プロピルブチル基、3-エチルペンチル基、オクチル基等が挙げられる。好ましくは、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基又は炭素数 4 乃至 8 の分岐鎖アルキル基（例えば、イソブチル基、*sec*-ブチル基、*tert*-ブチル基、イソペンチル基、ネオペンチル基、*tert*-ペンチル基、1-エチルプロピル基、2-エチルブチル基、1-プロピルブチル基等）である。

好ましくは、 R^3 においてメチル基、*tert*-ブチル基、1-エチルプロピル基であり、 R^{11} 、 R^{12} においてメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、イソブチル基、*sec*-ブチル基、*tert*-ブチル

基、イソペンチル基、ネオペンチル基、*tert*-ペンチル基、1-エチルプロピル基、2-エチルブチル基、1-プロピルブチル基である。
 R^{11} 、 R^{12} において特に好ましくは、イソプロピル基である。

「 C_{1-4} ハロアルキル基」とは、炭素数1乃至4の直鎖又は分岐鎖アルキル基が上記定義の「ハロゲン原子」で置換されたハロアルキル基を表し、具体的にはフルオロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、ブromoメチル基、クロロメチル基、1, 2-ジクロロメチル基、2, 2-ジクロロメチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基等が挙げられる。好ましくはトリフルオロメチル基である。

10 好ましくは、 R^3 においてトリフルオロメチル基である。

「 C_{1-4} アルキレン基」とは、炭素数1乃至4の直鎖又は分岐鎖アルキレン基を表し、メチレン基、エチレン基、トリメチレン基、プロピレン基、テトラメチレン基等が挙げられる。好ましくはメチレン基、エチレン基であり、より好ましくはメチレン基である。

15 好ましくは、Aにおいてメチレン基、エチレン基であり、 A^1 においてメチレン基である。

「 C_{1-4} アルコキシ基」とは、炭素数1乃至4の直鎖又は分岐鎖アルコキシ基を表し、具体的にはメトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、ブトキシ基、イソブトキシ基、*tert*-ブトキシ基等が挙げられる。好ましくはメトキシ基である。

好ましくは、 R^{22} 、 R^{25} においてメトキシ基である。

「 C_{1-6} アルコキシ基」とは、炭素数1乃至6の直鎖又は分岐鎖アルコキシ基を表し、具体的にはメトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、ブトキシ基、イソブトキシ基、*tert*-ブトキシ基、ペンチルオキシ基、イソペンチルオキシ基、ネオペンチルオキシ基、*tert*-ペンチルオキシ基、1-エチルプロポキシ基、ヘキシルオキシ基等が挙げられる。好ましくはメトキシ基、エトキシ基又は炭素数3乃至6の分岐鎖アルコキシ基（イソプロポキシ基、イソブトキシ基、*tert*-ブトキシ基、イソペンチルオキシ基、ネオペンチルオキシ基、*tert*-ペンチルオキシ基、1-エチルプロポキシ基等）である。

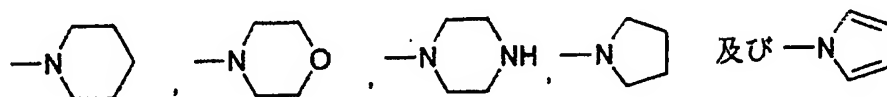
好ましくは、 R^3 においてメトキシ基、エトキシ基、イソプロポキシ基、イソブトキシ基、*tert*-ブトキシ基、イソペンチルオキシ基、ネオ

ペンチルオキシ基、tert-ペンチルオキシ基、1-エチルプロポキシ基である。

「アリール基」とは、炭素数6乃至14の芳香族炭化水素基を表し、具体的にはフェニル基、ナフチル基、ビフェニル基（例えば、2-ビフェニル基、3-ビフェニル基、4-ビフェニル基等）、アントリル基等が挙げられる。好ましくはフェニル基、ナフチル基、ビフェニル基であり、より好ましくはフェニル基である。

好ましくは、Zにおいてフェニル基、ビフェニル基であり、B、Eにおいてフェニル基であり、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} 、 R^{18} 、 R^{21} においてフェニル基、ナフチル基である。Zにおいて特に好ましくは、フェニル基である。

「ヘテロ環基」とは、「窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択される1乃至3個のヘテロ原子を含有する飽和又は不飽和の5乃至7員ヘテロ環基」を表し、具体的には、フリル基、チエニル基、ピロリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、ピラゾリル基、ピリジル基、ピリダジニル基、ピリミジニル基、ピラジニル基、テトラヒドロフリル基、テトラヒドロチエニル基、ピロリジニル基、ピラゾリジニル基、イミダゾリジニル基、オキサゾリジニル基、チアゾリジニル基、テトラヒドロピラニル基、ジオキサニル基、ピペリジニル基、ピペラジニル基、モルホリニル基等が挙げられ、好ましくは



からなる群より選択されるヘテロ環基である。

「芳香族ヘテロ環基」とは、「窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択される1～3個のヘテロ原子を含有する、単環又は縮合環の5～14員芳香族ヘテロ環基」を表し、具体的には、フリル基、チエニル基、ピロリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、ピラゾリル基、1, 3, 4-チアジアゾリル基、ピリジル基、ピリダジニル基、ピリミジニル基、

- ピラジニル基、インドリル基、イソインドリル基、ベンゾフラニル基、ベンゾチエニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、インドリジニル基、キノリル基、イソキノリル基、キナゾリニル基、シンノリニル基、キノキサリニル基、フタラジニル基、
- 5 アクリジニル基、フェナジニル基、ナフチリジニル基等が挙げられる。好ましくは、「窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択される1～3個のヘテロ原子を含有する、単環又は縮合環の5～10員芳香族ヘテロ環基」であり、フリル基、チエニル基、ピロリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、イミ
- 10 ダゾリル基、ピラゾリル基、1, 3, 4-チアジアゾリル基、ピリジル基、ピリダジニル基、ピリミジニル基、ピラジニル基、インドリル基、イソインドリル基、ベンゾフラニル基、ベンゾチエニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、インドリジニル基、キノリル基、イソキノリル基等が挙げられる。
- 15 好ましくは、Bにおいてチエニル基、チアゾリル基、ピラゾリル基、1, 3, 4-チアジアゾリル基、ピリジル基、ピリダジニル基、ピリミジニル基、インドリル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾオキサゾリル基であり、Eにおいてフリル基、イソオキサゾリル基、ピリジル基であり、Zにおいてチエニル基、ピリジル基であり、R⁴、
- 20 R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R⁹、R¹⁰、R¹⁵、R¹⁶、R¹⁷、R²¹においてオキサゾリル基、チアゾリル基、ピリジル基、ベンゾチエニル基、ベンゾイミダゾリル基、キノリル基である。

「C₃₋₇シクロアルキル基」とは、炭素数3乃至7のシクロアルキル基であり、具体的にはシクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基及びシクロヘプチル基である。好ましくは炭素

25 数5乃至7のシクロアルキル基であり、特に好ましくはシクロヘキシル基である。

好ましくは、Zにおいてシクロヘキシル基である。

「C₂₋₄アルケニル基」とは、炭素数2乃至4の直鎖又は分岐鎖アルケニル基を表し、具体的にはビニル基、1-プロペニル基、アリル基、1-オクチル-2-プロペニル基、1-ブテニル基、2-ブテニル基、3-ブテニル基等が挙げられる。

30

好ましくは、 R^{11} 、 R^{12} においてアリル基である。

- 「 C_{1-4} アルキルスルホニル基」とは、「アルキル」部分として前記定義の「 C_{1-4} アルキル基」を有するアルキルスルホニル基であり、具体的にはメチルスルホニル基、エチルスルホニル基、プロピルスルホニル基、
5 イソプロピルスルホニル基、ブチルスルホニル基、イソブチルスルホニル基、*sec*-ブチルスルホニル基、*tert*-ブチルスルホニル基が挙げられる。

好ましくは、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{23} 、 R^{24} においてメチルスルホニル基（即ち、メシル基）である。

- 10 「 C_{1-4} アルキルカルボニル基」とは、「アルキル」部分として前記定義の「 C_{1-4} アルキル基」を有するアルキルカルボニル基であり、具体的にはアセチル基、プロピオニル基、ブチリル基、イソブチリル基、バレリル基、イソバレリル基、ピバロイル基等が挙げられる。

- 好ましくは、 R^{11} 、 R^{12} においてアセチル基であり、 R^{23} 、 R^{24} において
15 アセチル基、イソブチリル基である。

- 「 C_{1-4} アルコキシカルボニル基」とは、「アルコキシ」部分として前記定義の「 C_{1-4} アルコキシ基」を有するアルコキシカルボニル基であり、具体的にはメトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、プロポキシカルボニル基、イソプロポキシカルボニル基、ブトキシカルボニル基、
20 イソブトキシカルボニル基、*tert*-ブトキシカルボニル基等が挙げられる。

「アリールオキシ基」とは、「アリール」部分として前記定義の「アリール基」を有するアリールオキシ基であり、具体的にはフェノキシ基、ナフチルオキシ基等が挙げられる。

- 25 「アラルキル基」とは、「アリール基」で置換された「 C_{1-4} アルキル基」であり、かかる「アリール基」及び「 C_{1-4} アルキル基」は前記定義の通りである。「アラルキル基」としては、具体的にはベンジル基等が挙げられる。

- 「 C_{1-4} アルキルアミノ基」とは、「アルキル」部分として前記定義の「 C_{1-4} アルキル基」を有するアルキルアミノ基であり、具体的には、メチルアミノ基、エチルアミノ基、プロピルアミノ基、イソプロピルアミノ基、ブチルアミノ基、イソブチルアミノ基、*sec*-ブチルアミノ基、
30 「 C_{1-4} アルキル基」を有するアルキルアミノ基であり、具体的には、メチルアミノ基、エチルアミノ基、プロピルアミノ基、イソプロピルアミノ基、ブチルアミノ基、イソブチルアミノ基、*sec*-ブチルアミノ基、

tert-ブチルアミノ基等が挙げられる。

「C₁₋₆ アルキルアミノ基」とは、「アルキル」部分として前記定義の「C₁₋₆ アルキル基」を有するアルキルアミノ基であり、具体的には、メチルアミノ基、エチルアミノ基、プロピルアミノ基、イソプロピルアミノ基、
5 tert-ブチルアミノ基、イソブチルアミノ基、sec-ブチルアミノ基、tert-ブチルアミノ基、ペンチルアミノ基、イソペンチルアミノ基、ネオペンチルアミノ基、tert-ペンチルアミノ基、ヘキシルアミノ基等が挙げられる。

好ましくは、R²²、R²⁵においてメチルアミノ基、エチルアミノ基、イソプロピルアミノ基、イソブチルアミノ基、sec-ブチルアミノ基、
10 tert-ブチルアミノ基、イソペンチルアミノ基、ネオペンチルアミノ基、tert-ペンチルアミノ基である。

「ジ(C₁₋₄ アルキル)アミノ基」とは、「アルキル」部分として前記定義の「C₁₋₄ アルキル基」を有するジ(アルキル)アミノ基であり、具体的には、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、ジプロピルアミノ基、
15 ジイソプロピルアミノ基、ジブチルアミノ基、ジイソブチルアミノ基、ジ(sec-ブチル)アミノ基、ジ(tert-ブチル)アミノ基、N-エチル-N-メチルアミノ基、N-メチル-N-プロピルアミノ基、N-エチル-N-プロピルアミノ基等が挙げられる。

20 「ジ(C₁₋₆ アルキル)アミノ基」とは、「アルキル」部分として前記定義の「C₁₋₆ アルキル基」を有するジ(アルキル)アミノ基であり、具体的には、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、ジプロピルアミノ基、ジイソプロピルアミノ基、ジブチルアミノ基、ジイソブチルアミノ基、ジ(sec-ブチル)アミノ基、ジ(tert-ブチル)アミノ基、ジペンチルアミノ基、
25 ジイソペンチルアミノ基、ジ(tert-ペンチル)アミノ基、ジヘキシルアミノ基、N-エチル-N-メチルアミノ基、N-メチル-N-プロピルアミノ基、N-エチル-N-プロピルアミノ基等が挙げられる。

好ましくは、R²²、R²⁵においてジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、
30 ジプロピルアミノ基、ジブチルアミノ基、ジペンチルアミノ基、ジイソペンチルアミノ基、ジヘキシルアミノ基、N-エチル-N-メチルアミノ基、N-メチル-N-プロピルアミノ基、N-エチル-N-プロピル

アミノ基である。

「C₁₋₆ アルキルチオ基」とは、「アルキル」部分として前記定義の「C₁₋₆ アルキル基」を有するアルキルチオ基であり、具体的には、メチルチオ基、エチルチオ基、プロピルチオ基、イソプロピルチオ基、ブチルチオ基、イソブチルチオ基、sec-ブチルチオ基、tert-ブチルチオ基、ペンチルチオ基、イソペンチルチオ基、ネオペンチルチオ基、tert-ペンチルチオ基、1-エチルプロピルチオ基、ヘキシルチオ基等が挙げられる。

好ましくは、R²²、R²⁵においてメチルチオ基である。

「ジ(C₁₋₆ アルキル) アミノカルボニル基」とは、「ジ(C₁₋₆ アルキル) アミノ」部分として前記定義の「ジ(C₁₋₆ アルキル) アミノ基」を有するジ(アルキル) アミノカルボニル基であり、具体的には、ジメチルアミノカルボニル基、ジエチルアミノカルボニル基、ジプロピルアミノカルボニル基、ジイソプロピルアミノカルボニル基、ジブチルアミノカルボニル基、ジイソブチルアミノカルボニル基、ジ(sec-ブチル)アミノカルボニル基、ジ(tert-ブチル)アミノカルボニル基、ジペンチルアミノカルボニル基、ジイソペンチルアミノカルボニル基、ジ(tert-ペンチル)アミノカルボニル基、ジヘキシルアミノカルボニル基、N-エチル-N-メチルアミノカルボニル基、N-メチル-N-プロピルアミノカルボニル基、N-エチル-N-プロピルアミノカルボニル基等が挙げられる。

Rにおける-COO(R¹⁹)部分の、R¹⁹が水素原子の場合、このカルボキシ基は塩を形成していてもよい。塩としてはアルカリ金属塩(例えば、カリウム塩、ナトリウム塩等)、アルカリ土類金属塩(例えば、カルシウム塩、マグネシウム塩等)等が挙げられる。好ましくはナトリウム塩、カルシウム塩である。

R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R⁹、R¹⁰における「C₁₋₆ アルキル基」は、置換されてもよいアリール基、置換されてもよい芳香族ヘテロ環基、カルボキシ基、C₁₋₄ アルコキシカルボニル基、-CO-N(R¹⁵)(R¹⁶)、-N(R¹⁵)(R¹⁶)、-O-R¹⁷、-CO-R¹⁷、-SO₂-R¹⁷又はC₃₋₇ シクロアルキル基で置換されていてもよい。かかる「C₁₋₆ アルキル基」は、例えばベンズヒドリル基のように、複数の置換基により置換されたC₁₋₆

アルキル基であってもよい。好ましくは、置換基の数は1である。かかる「C₁₋₆アルキル基」が置換されている場合、「C₁₋₆アルキル基」部分として好ましくは、メチル基である。

5 R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R⁹、R¹⁰における「C₁₋₆アルキル基」上の置換基である「置換されてもよいアリール基」の「アリール基」部分とは、前記定義の「アリール基」であり、好ましくは、フェニル基、ナフチル基である。

10 R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R⁹、R¹⁰における「C₁₋₆アルキル基」上の置換基である「置換されてもよいアリール基」は、次の中から選択される1乃至3個の置換基で置換されてもよい。かかる置換基としては、ハロゲン原子、C₁₋₈アルキル基、ジ(C₁₋₆アルキル)アミノカルボニル基で置換されたC₁₋₈アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、C₂₋₄アルケニル基、カルボキシ基、水酸基、シアノ基、ニトロ基、アミノ基、C₁₋₄アルキルアミノ基、ジ(C₁₋₄アルキル)アミノ基、1-ピロリジニル基、1-ピペリジル基、モルホリノ基、C₁₋₄アルコキシカルボニル基、C₁₋₆アルキルチオ基、ハロゲン原子で置換されてもよい芳香族ヘテロ環基、アラルキル基等が挙げられる。好ましい置換基は、ハロゲン原子（例えば、フッ素原子、塩素原子等）、C₁₋₈アルキル基（例えば、メチル基、イソプロピル基、tert-ブチル基、1-プロピルブチル基等）、C₁₋₄ハロアルキル基（例えば、トリフルオロメチル基等）、C₂₋₄アルケニル基（例えば、アリル基等）、C₁₋₆アルキルチオ基（例えば、メチルチオ基等）、ジ(C₁₋₆アルキル)アミノカルボニル基（例えば、ジエチルアミノカルボニル基等）で置換されたC₁₋₈アルキル基（例えば、メチル基等）、ハロゲン原子（例えば、塩素原子等）で置換されてもよい芳香族ヘテロ環基（例えば、チエニル基、イミダゾリル基等）、アラルキル基（例えば、ベンジル基等）である。

15 20 25

R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R⁹、R¹⁰における「C₁₋₆アルキル基」上の置換基である「置換されてもよい芳香族ヘテロ環基」の「芳香族ヘテロ環基」部分とは、前記定義の「芳香族ヘテロ環基」であり、好ましくは、オキサゾリル基、チアゾリル基、ピリジル基、ベンゾチエニル基、ベンゾイミダゾリル基、キノリル基である。

30

R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R⁹、R¹⁰における「C₁₋₆アルキル基」上の置

換基である「置換されてもよい芳香族ヘテロ環基」は、次の中から選択される1乃至3個の置換基で置換されてもよい。かかる置換基としては、ハロゲン原子、 C_{1-8} アルキル基、ジ(C_{1-6} アルキル)アミノカルボニル基で置換された C_{1-8} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、 C_{2-4} アルケニル基、カルボキシ基、水酸基、シアノ基、ニトロ基、アミノ基、 C_{1-4} アルキルアミノ基、ジ(C_{1-4} アルキル)アミノ基、1-ピロリジニル基、1-ピペリジル基、モルホリノ基、 C_{1-4} アルコキシカルボニル基、 C_{1-6} アルキルチオ基、ハロゲン原子で置換されてもよいアリール基、ハロゲン原子で置換されてもよい芳香族ヘテロ環基、アラルキル基等が挙げられる。好ましい置換基は、ハロゲン原子(例えば、フッ素原子、塩素原子等)、 C_{1-8} アルキル基(例えば、メチル基、イソプロピル基、tert-ブチル基、1-プロピルブチル基等)、 C_{1-4} ハロアルキル基(例えば、トリフルオロメチル基等)、 C_{2-4} アルケニル基(例えば、アリル基等)、 C_{1-6} アルキルチオ基(例えば、メチルチオ基等)、ジ(C_{1-6} アルキル)アミノカルボニル基(例えば、ジエチルアミノカルボニル基等)で置換された C_{1-8} アルキル基(例えば、メチル基等)、ハロゲン原子(例えば、塩素原子等)で置換されてもよいアリール基(例えば、フェニル基等)、ハロゲン原子(例えば、塩素原子等)で置換されてもよい芳香族ヘテロ環基(例えば、チエニル基、イミダゾリル基等)、アラルキル基(例えば、ベンジル基等)である。

R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} における「 C_{1-6} アルキル基」上の置換基である「 C_{1-4} アルコキシカルボニル基」とは、前記定義の「 C_{1-4} アルコキシカルボニル基」であり、好ましくは、エトキシカルボニル基、プロポキシカルボニル基、イソブトキシカルボニル基である。

R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} における「 C_{1-6} アルキル基」上の置換基である「 C_{3-7} シクロアルキル基」とは、前記定義の「 C_{3-7} シクロアルキル基」であり、好ましくは、シクロヘキシル基である。

R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} における「置換されてもよいアリール基」は、次の中から選択される1乃至3個の置換基で置換されてもよい。かかる置換基としては、ハロゲン原子、 C_{1-8} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、カルボキシ基、水酸基、シアノ基、ニトロ基、アミノ基、 C_{1-4} アルキルアミノ基、ジ(C_{1-4} アルキル)アミノ

基、1-ピロリジニル基、1-ピペリジル基、モルホリノ基、 C_{1-4} アルコキシカルボニル基、ハロゲン原子で置換されてもよい芳香族ヘテロ環基、アラルキル基等が挙げられる。好ましい置換基は、ハロゲン原子（例えば、フッ素原子、塩素原子等）、 C_{1-8} アルキル基（例えば、メチル
5 基、イソプロピル基、tert-ブチル基、1-プロピルブチル基等）、 C_{1-4} ハロアルキル基（例えば、トリフルオロメチル基等）、ハロゲン原子（例えば、塩素原子等）で置換されてもよい芳香族ヘテロ環基（例えば、チエニル基、イミダゾリル基等）、アラルキル基（例えば、ベンジル基等）である。

10 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} における「置換されてもよい芳香族ヘテロ環基」は、次の中から選択される1乃至3個の置換基で置換されてもよい。かかる置換基としては、ハロゲン原子、 C_{1-8} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、カルボキシ基、水酸基、シアノ基、ニトロ基、アミノ基、 C_{1-4} アルキルアミノ基、ジ(C_{1-4} アルキル)アミ
15 ノ基、1-ピロリジニル基、1-ピペリジル基、モルホリノ基、 C_{1-4} アルコキシカルボニル基、ハロゲン原子で置換されてもよいアリール基、ハロゲン原子で置換されてもよい芳香族ヘテロ環基、アラルキル基等が挙げられる。好ましい置換基は、ハロゲン原子（例えば、フッ素原子、塩素原子等）、 C_{1-8} アルキル基（例えば、メチル基、イソプロピル基、t
20 ert-ブチル基、1-プロピルブチル基等）、 C_{1-4} ハロアルキル基（例えば、トリフルオロメチル基等）、ハロゲン原子（例えば、塩素原子等）で置換されてもよいアリール基（例えば、フェニル基等）、ハロゲン原子（例えば、塩素原子等）で置換されてもよい芳香族ヘテロ環基（例えば、チエニル基、イミダゾリル基等）、アラルキル基（例えば、ベンジル基
25 等）である。

R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} における「置換されてもよいアリール基」は、次の中から選択される1乃至3個の置換基で置換されてもよい。かかる置換基としては、ハロゲン原子、 C_{1-8} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、カルボキシ基、水酸基、シアノ基、ニトロ基、アミノ基、
30 C_{1-4} アルキルアミノ基、ジ(C_{1-4} アルキル)アミノ基、1-ピロリジニル基、1-ピペリジル基、モルホリノ基、 C_{1-4} アルコキシカルボニル基等が挙げられる。好ましい置換基は、ハロゲン原子（例えば、塩素原子

等)、 C_{1-8} アルキル基 (例えば、メチル基、イソプロピル基等)、 C_{1-4} アルコキシ基 (例えば、メトキシ基等)、カルボキシ基、ジ (C_{1-4} アルキル) アミノ基 (例えば、ジメチルアミノ基等) である。

R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} における「置換されてもよい芳香族ヘテロ環基」は、
5 次の中から選択される 1 乃至 3 個の置換基で置換されてもよい。かかる置換基としては、ハロゲン原子、 C_{1-8} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、カルボキシ基、水酸基、シアノ基、ニトロ基、アミノ基、 C_{1-4} アルキルアミノ基、ジ (C_{1-4} アルキル) アミノ基、1-ピロリジニル基、1-ピペリジル基、モルホリノ基、 C_{1-4} アルコキシカルボ
10 ニル基等が挙げられる。好ましい置換基は、ハロゲン原子 (例えば、塩素原子等)、 C_{1-8} アルキル基 (例えば、メチル基、イソプロピル基等)、 C_{1-4} アルコキシ基 (例えば、メトキシ基等)、カルボキシ基、ジ (C_{1-4} アルキル) アミノ基 (例えば、ジメチルアミノ基等) である。

R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} における「 C_{1-6} アルキル基」は、置換されてもよいアリール基、置換されてもよい芳香族ヘテロ環基、アリール基で置換されてもよい C_{1-4} アルコキシ基又は置換されてもよいアリールオキシ基で置換されていてもよい。かかる「 C_{1-6} アルキル基」が置換されている場合の「 C_{1-6} アルキル基」部分として好ましくは、メチル基である。

R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} における「 C_{1-6} アルキル基」上の置換基である「置換
20 されてもよいアリール基」の「アリール基」部分とは、前記定義の「アリール基」であり、好ましくは、フェニル基、ナフチル基である。

R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} における「 C_{1-6} アルキル基」上の置換基である「置換されてもよいアリール基」は、次の中から選択される 1 乃至 3 個の置換基で置換されてもよい。かかる置換基としては、ハロゲン原子、 C_{1-8} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、カルボキシ基、水
25 酸基、シアノ基、ニトロ基、アミノ基、 C_{1-4} アルキルアミノ基、ジ (C_{1-4} アルキル) アミノ基、1-ピロリジニル基、1-ピペリジル基、モルホリノ基、 C_{1-4} アルコキシカルボニル基等が挙げられる。好ましい置換基は、ハロゲン原子 (例えば、塩素原子等)、 C_{1-8} アルキル基 (例えば、メ
30 チル基、イソプロピル基等)、 C_{1-4} アルコキシ基 (例えば、メトキシ基等)、カルボキシ基、ジ (C_{1-4} アルキル) アミノ基 (例えば、ジメチルアミノ基等)、1-ピロリジニル基、1-ピペリジル基、モルホリノ基であ

る。

R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} における「 C_{1-6} アルキル基」上の置換基である「置換されてもよい芳香族ヘテロ環基」の「芳香族ヘテロ環基」部分とは、前記定義の「芳香族ヘテロ環基」であり、好ましくは、オキサゾリル基、
5 チアゾリル基、ピリジル基、ベンゾチエニル基、ベンゾイミダゾリル基、キノリル基である。

R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} における「 C_{1-6} アルキル基」上の置換基である「置換されてもよい芳香族ヘテロ環基」は、次の中から選択される 1 乃至 3 個の置換基で置換されてもよい。かかる置換基としては、ハロゲン原子、
10 C_{1-8} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、カルボキシ基、水酸基、シアノ基、ニトロ基、アミノ基、 C_{1-4} アルキルアミノ基、ジ (C_{1-4} アルキル) アミノ基、1-ピロリジニル基、1-ピペリジル基、モルホリノ基、 C_{1-4} アルコキシカルボニル基等が挙げられる。好ましい置換基は、ハロゲン原子 (例えば、塩素原子等)、 C_{1-8} アルキル基 (例え
15 ば、メチル基、イソプロピル基等)、 C_{1-4} アルコキシ基 (例えば、メトキシ基等)、カルボキシ基、ジ (C_{1-4} アルキル) アミノ基 (例えば、ジメチルアミノ基等)、1-ピロリジニル基、1-ピペリジル基、モルホリノ基である。

R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} における「 C_{1-6} アルキル基」上の置換基である「アリアル基で置換されてもよい C_{1-4} アルコキシ基」の「 C_{1-4} アルコキシ基」部分とは、前記定義の「 C_{1-4} アルコキシ基」であり、好ましくはメトキシ基である。

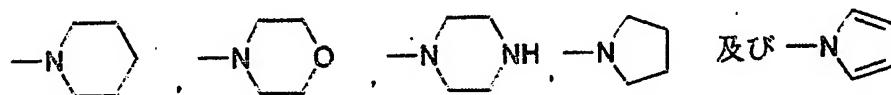
R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} における「 C_{1-6} アルキル基」上の置換基である「アリアル基で置換されてもよい C_{1-4} アルコキシ基」の「アリアル基」部分とは、前記定義の「アリアル基」であり、好ましくはフェニル基である。
25

R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} における「 C_{1-6} アルキル基」上の置換基である「置換されてもよいアリアルオキシ基」の「アリアルオキシ基」部分とは、前記定義の「アリアルオキシ基」であり、好ましくはフェノキシ基である。

R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} における「 C_{1-6} アルキル基」上の置換基である「置換されてもよいアリアルオキシ基」は、次の中から選択される 1 乃至 3 個の置換基で置換されてもよい。かかる置換基としては、ハロゲン原子、
30 C_{1-8} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、カルボキシ

基、水酸基、シアノ基、ニトロ基、アミノ基、 C_{1-4} アルキルアミノ基、ジ (C_{1-4} アルキル) アミノ基、1-ピロリジニル基、1-ピペリジル基、モルホリノ基、 C_{1-4} アルコキシカルボニル基等が挙げられる。好ましい置換基は、ハロゲン原子 (例えば、塩素原子等)、 C_{1-8} アルキル基 (例えば、メチル基、イソプロピル基等)、 C_{1-4} アルコキシ基 (例えば、メトキシ基等)、カルボキシ基、ジ (C_{1-4} アルキル) アミノ基 (例えば、ジメチルアミノ基等)、1-ピロリジニル基、1-ピペリジル基、モルホリノ基である。

R^{15} 及び R^{16} が、それらが結合する窒素原子と一緒に形成する「さらに窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択される少なくとも1つのヘテロ原子を含有してもよい5乃至7員ヘテロ環」とは、好ましくは、「窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択される1乃至3個のヘテロ原子を含有する飽和又は不飽和5〜7員ヘテロ環」であり、具体的には、



からなる群より選択されるヘテロ環である。

R^{21} における「 C_{1-6} アルキル基」は、置換されてもよいアリール基又は置換されてもよい芳香族ヘテロ環基で置換されていてもよい。

R^{21} における「 C_{1-6} アルキル基」上の置換基である「置換されてもよいアリール基」の「アリール基」部分とは、前記定義の「アリール基」であり、好ましくはフェニル基である。

R^{21} における「 C_{1-6} アルキル基」上の置換基である「置換されてもよいアリール基」は、次の中から選択される1乃至3個の置換基で置換されてもよい。かかる置換基としては、ハロゲン原子、 C_{1-8} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、カルボキシ基、水酸基、シアノ基、ニトロ基、アミノ基、 C_{1-4} アルキルアミノ基、ジ (C_{1-4} アルキル) アミノ基、1-ピロリジニル基、1-ピペリジル基、モルホリノ基、 C_{1-4} アルコキシカルボニル基等が挙げられる。好ましい置換基は、ハロゲン原子 (例えば、塩素原子、フッ素原子等)、 C_{1-8} アルキル基 (例えば、メチ

ル基等)、 C_{1-4} ハロアルキル基 (例えば、トリフルオロメチル基等) である。

R^{21} における「 C_{1-6} アルキル基」上の置換基である「置換されてもよい芳香族ヘテロ環基」の「芳香族ヘテロ環基」部分とは、前記定義の「芳香族ヘテロ環基」であり、好ましくは、オキサゾリル基、チアゾリル基、ピリジル基、ベンゾチエニル基、ベンゾイミダゾリル基、キノリル基である。

R^{21} における「 C_{1-6} アルキル基」上の置換基である「置換されてもよい芳香族ヘテロ環基」は、次の中から選択される 1 乃至 3 個の置換基で置換されてもよい。かかる置換基としては、ハロゲン原子、 C_{1-8} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、カルボキシ基、水酸基、シアノ基、ニトロ基、アミノ基、 C_{1-4} アルキルアミノ基、ジ (C_{1-4} アルキル) アミノ基、1-ピロリジニル基、1-ピペリジル基、モルホリノ基、 C_{1-4} アルコキシカルボニル基等が挙げられる。好ましい置換基は、ハロゲン原子 (例えば、塩素原子、フッ素原子等)、 C_{1-8} アルキル基 (例えば、メチル基等)、 C_{1-4} ハロアルキル基 (例えば、トリフルオロメチル基等) である。

R^{21} における「置換されてもよいアリール基」は、次の中から選択される 1 乃至 3 個の置換基で置換されてもよい。かかる置換基としては、ハロゲン原子、 C_{1-2} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、カルボキシ基、水酸基、シアノ基、ニトロ基、アミノ基、 C_{1-4} アルキルアミノ基、ジ (C_{1-4} アルキル) アミノ基、1-ピロリジニル基、1-ピペリジル基、モルホリノ基、 C_{1-4} アルコキシカルボニル基等が挙げられる。好ましい置換基は、ハロゲン原子 (例えば、塩素原子、フッ素原子等)、 C_{1-8} アルキル基 (例えば、メチル基等)、 C_{1-4} ハロアルキル基 (例えば、トリフルオロメチル基等) である。

R^{21} における「置換されてもよい芳香族ヘテロ環基」は、次の中から選択される 1 乃至 3 個の置換基で置換されてもよい。かかる置換基としては、ハロゲン原子、 C_{1-8} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、カルボキシ基、水酸基、シアノ基、ニトロ基、アミノ基、 C_{1-4} アルキルアミノ基、ジ (C_{1-4} アルキル) アミノ基、1-ピロリジニル基、1-ピペリジル基、モルホリノ基、 C_{1-4} アルコキシカルボニル基等が挙

げられる。好ましい置換基は、ハロゲン原子（例えば、塩素原子、フッ素原子等）、 C_{1-8} アルキル基（例えば、メチル基等）、 C_{1-4} ハロアルキル基（例えば、トリフルオロメチル基等）である。

R^{23} 、 R^{24} における「 C_{1-4} アルキルカルボニル基」は、アミノ基、 C_{1-4} アルキルアミノ基又はジ（ C_{1-4} アルキル）アミノ基で置換されていてもよい。

R^{23} 、 R^{24} における「 C_{1-6} アルキルカルボニル基」上の置換基である「 C_{1-4} アルキルアミノ基」とは、前記定義の「 C_{1-4} アルキルアミノ基」であり、好ましくはメチルアミノ基である。

10 R^{23} 、 R^{24} における「 C_{1-6} アルキルカルボニル基」上の置換基である「ジ（ C_{1-4} アルキル）アミノ基」とは、前記定義の「ジ（ C_{1-4} アルキル）アミノ基」であり、好ましくはジメチルアミノ基である。

R^{11} 、 R^{12} における「 C_{1-8} アルキル基」は、 C_{3-7} シクロアルキル基、置換されてもよいアリール基、置換されてもよいヘテロ環基、水酸基、 C_{1-4} アルキルアミノ基及びジ（ C_{1-4} アルキル）アミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい。

R^{11} 、 R^{12} における「 C_{1-6} アルキル基」上の置換基である「置換されてもよいアリール基」の「アリール基」部分とは、前記定義の「アリール基」であり、好ましくはフェニル基である。

20 R^{11} 、 R^{12} における「 C_{1-6} アルキル基」上の置換基である「置換されてもよいアリール基」は、次の中から選択される1乃至3個の置換基で置換されてもよい。かかる置換基としては、ハロゲン原子、 C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} ハロアルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、カルボキシ基、水酸基、シアノ基、ニトロ基、アミノ基、 C_{1-4} アルコキシカルボニル基等が挙げられる。好ましい置換基は、ハロゲン原子又は C_{1-4} ハロアルキル基である。

R^{11} 、 R^{12} における「 C_{1-8} アルキル基」上の置換基である「置換されてもよいヘテロ環基」の「ヘテロ環基」部分とは、「窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択される1乃至3個のヘテロ原子を含有する飽和又は不飽和の5乃至7員ヘテロ環基」であり、具体的には、フリル基、チエニル基、ピロリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、ピラゾリル基、ピ

リジル基、ピリダジニル基、ピリミジニル基、ピラジニル基、テトラヒドロフリル基、テトラヒドロチエニル基、ピロリジニル基、ピラゾリジニル基、イミダゾリジニル基、オキサゾリジニル基、チアゾリジニル基、テトラヒドロピラニル基、ジオキサニル基、ピペリジニル基、ピペラジニル基、モルホリニル基等が挙げられ、好ましくはテトラヒドロピラニル基である。

R¹¹、R¹²における「C₁₋₈アルキル基」上の置換基である「置換されてもよいヘテロ環基」は、次の中から選択される1乃至3個の置換基で置換されてもよい。かかる置換基としては、ハロゲン原子、C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄ハロアルキル基、C₁₋₄アルコキシ基、カルボキシ基、水酸基、シアノ基、ニトロ基、アミノ基、C₁₋₄アルコキシカルボニル基等が挙げられる。

R¹¹、R¹²における「C₁₋₈アルキル基」上の置換基である「C₁₋₄アルキルアミノ基」とは、前記定義の「C₁₋₄アルキルアミノ基」であり、好ましくはメチルアミノ基である。

R¹¹、R¹²における「C₁₋₈アルキル基」上の置換基である「ジ(C₁₋₄アルキル)アミノ基」とは、前記定義の「ジ(C₁₋₄アルキル)アミノ基」であり、好ましくはジメチルアミノ基である。

R¹¹、R¹²における「C₁₋₄アルキルカルボニル基」は、水酸基又はC₁₋₄アルコキシ基で置換されていてもよい。

R¹¹、R¹²における「C₁₋₄アルキルカルボニル基」上の置換基である「C₁₋₄アルコキシ基」とは、前記定義の「C₁₋₄アルコキシ基」である。

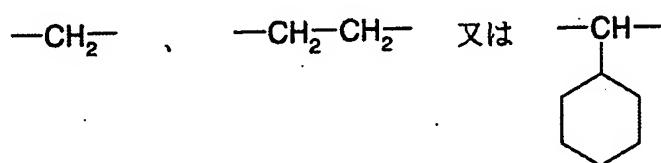
R¹³及びR¹⁴が、それらが結合する炭素原子と一緒に形成する「C₃₋₇シクロアルカン」とは、炭素数3乃至7のシクロアルカンであり、具体的にはシクロプロパン、シクロブタン、シクロペンタン、シクロヘキサン及びシクロヘプタンである。好ましくは炭素数5乃至7のシクロアルカンであり、特に好ましくはシクロペンタン又はシクロヘキサンである。

R¹³及びR¹⁴が、それらが結合する炭素原子と一緒に形成する「さらに窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択される少なくとも1つのヘテロ原子を含有してもよい5乃至7員ヘテロ環」とは、好ましくは、「窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択され

る 1 乃至 3 個のヘテロ原子を含有してもよい飽和の 5 乃至 7 員ヘテロ環」であり、具体的には、テトラヒドロピラン、チアン等が挙げられ、特に好ましくは、テトラヒドロピランである。

A における C_{1-4} アルキレン基は、 C_{3-7} シクロアルキル基で置換されていてもよい。かかる C_{3-7} シクロアルキル基としては、前記定義の「 C_{3-7} シクロアルキル基」が挙げられる。

A における「 C_{3-7} シクロアルキル基で置換されてもよい C_{1-4} アルキレン基」としては、好ましくは、



10 であり、より好ましくは、 $\text{—CH}_2\text{—}$ である。

Z における「 C_{3-7} シクロアルキル基」は、好ましくはシクロペンチル基又はシクロヘキシル基であり、より好ましくはシクロヘキシル基である。

Z における「 C_{3-7} シクロアルキル基」は、アリール基（当該アリール基は 1 乃至 5 個（好ましくは 1 乃至 3 個）のハロゲン原子又は C_{1-6} アルキル基で置換されていてもよい）又は芳香族ヘテロ環基（当該芳香族ヘテロ環基は 1 乃至 5 個（好ましくは 1 乃至 3 個）のハロゲン原子又は C_{1-6} アルキル基で置換されていてもよい）で置換されていてもよい。かかる「 C_{3-7} シクロアルキル基」の置換基は、好ましくは 1 乃至 3 個のハロゲン原子又は C_{1-6} アルキル基で置換されていてもよいフェニル基である。

Z における「アリール基」は、好ましくはフェニル基、ビフェニル基（例えば、2-ビフェニル基、3-ビフェニル基、4-ビフェニル基）であり、より好ましくはフェニル基である。

Z における「アリール基」は、次の中から選択される 1 乃至 5 個（好ましくは 1 乃至 3 個）の置換基で置換されていてもよい。

(a) C_{1-4} アルキル基又は C_{1-4} アルキルカルボニル基で置換されてもよいヘテロ環基、

(b) 水酸基、オキソ基、ハロゲン原子又は C_{1-6} アルキル基で置換されても

- よい C_{3-7} シクロアルキル基、
 (c) カルボキシ基、
 (d) ハロゲン原子、
 (e) C_{1-8} アルキル基、
 5 (f) C_{1-4} ハロアルキル基、
 (g) C_{1-4} アルキルアミノ基、
 (h) ジ (C_{1-4} アルキル) アミノ基、
 (i) C_{1-6} アルキルチオ基、
 (j) C_{1-4} アルコキシ基、
 10 (k) C_{1-4} アルキルカルボニル基及び
 (l) ニトロ基。

かかる置換基として、 C_{1-8} アルキル基が好ましい。

- Z における「アリール基」上の置換基である「 C_{1-4} アルキル基又は C_{1-4} アルキルカルボニル基で置換されてもよいヘテロ環基」における「ヘテロ環基」は、好ましくは、「窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択される 1 ～ 3 個のヘテロ原子を含有する飽和又は不飽和の 5 ～ 7 員ヘテロ環基」であり、具体的には、フリル基、チエニル基、ピロリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、ピラゾリル基、ピリジル基、ピリダジニル基、ピリミジニル基、ピラジニル基、テトラヒドロフリル基、テトラヒドロチエニル基、ピロリジニル基、ピラゾリジニル基、イミダゾリジニル基、オキサゾリジニル基、チアゾリジニル基、テトラヒドロピラニル基、ジオキサニル基、ピペリジニル基、ピペラジニル基、モルホリニル基等が挙げられる。好ましくはピペリジニル基、モルホリニル基、ピペラジニル基、ピロリジニル基、ピロリル基、テトラヒドロピラニル基である。
- 25

当該「ヘテロ環基」上の置換基としては、好ましくは、 C_{1-4} アルキル基又は C_{1-4} アルキルカルボニル基である。

- Z における「アリール基」上の置換基である「水酸基、オキソ基、ハロゲン原子又は C_{1-6} アルキル基で置換されてもよい C_{3-7} シクロアルキル基」における「 C_{3-7} シクロアルキル」は、好ましくはシクロペンチル基又はシクロヘキシル基であり、より好ましくはシクロヘキシル基である。
- 30

当該「C₃₋₇ シクロアルキル基」は、水酸基、オキソ基、ハロゲン原子及びC₁₋₆ アルキル基からなる群より選択される1乃至5個（好ましくは1乃至3個）の置換基で置換されていてもよい。当該「C₃₋₇ シクロアルキル基」上の置換基としては、好ましくは、ハロゲン原子又はC₁₋₄ アルキル基である。

Zにおける「アリール基」上の置換基である「ハロゲン原子」としては、前記定義の「ハロゲン原子」が挙げられ、好ましくは、フッ素原子、塩素原子又は臭素原子であり、特に好ましくは、塩素原子である。

Zにおける「アリール基」上の置換基である「C₁₋₈ アルキル基」としては、前記定義の「C₁₋₈ アルキル基」が挙げられる。好ましくは、イソプロピル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、イソペンチル基、ネオペンチル基、tert-ペンチル基、1-エチルプロピル基、1-プロピルブチル基であり、より好ましくは、イソペンチル基、ネオペンチル基、tert-ペンチル基、1-エチルプロピル基、1-プロピルブチル基であり、特に好ましくは、ネオペンチル基、1-エチルプロピル基、1-プロピルブチル基である。

Zにおける「アリール基」上の置換基である「C₁₋₄ ハロアルキル基」としては、前記定義の「C₁₋₄ ハロアルキル基」が挙げられ、好ましくは、トリフルオロメチル基である。

Zにおける「アリール基」上の置換基である「C₁₋₄ アルキルアミノ基」としては、前記定義の「C₁₋₄ アルキルアミノ基」が挙げられ、好ましくは、メチルアミノ基、エチルアミノ基又はイソプロピルアミノ基である。

Zにおける「アリール基」上の置換基である「ジ(C₁₋₄ アルキル)アミノ基」としては、前記定義の「ジ(C₁₋₄ アルキル)アミノ基」が挙げられ、好ましくは、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基又はジプロピルアミノ基である。

Zにおける「アリール基」上の置換基である「C₁₋₆ アルキルチオ基」としては、前記定義の「C₁₋₆ アルキルチオ基」が挙げられ、好ましくは、イソペンチルチオ基である。

Zにおける「アリール基」上の置換基である「C₁₋₄ アルコキシ基」としては、前記定義の「C₁₋₄ アルコキシ基」が挙げられる。

Zにおける「アリール基」上の置換基である「C₁₋₄ アルキルカルボニル基」としては、前記定義の「C₁₋₄ アルキルカルボニル基」が挙げられ、好ましくは、アセチル基である。

Zにおける「芳香族ヘテロ環基」は、好ましくは、「窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択される1～3個のヘテロ原子を含有する、単環又は縮合環の5～10員芳香族ヘテロ環基」であり、フリル基、チエニル基、ピロリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、ピラゾリル基、ピリジル基、ピリダジニル基、ピリミジニル基、ピラジニル基、インドリル基、イソインドリル基、ベンゾフラニル基、ベンゾチエニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾオキサゾリル基等が挙げられる。特に好ましくは、チアゾリル基又はピリジル基である。

Zにおける「芳香族ヘテロ環基」は、次の中から選択される1乃至5個（好ましくは1乃至3個）の置換基で置換されていてもよい。

- 15 (a) C₁₋₄ アルキル基又はC₁₋₄ アルキルカルボニル基で置換されてもよいヘテロ環基、
- (b) 水酸基、オキソ基、ハロゲン原子又はC₁₋₈ アルキル基で置換されてもよいC₃₋₇ シクロアルキル基、
- (c) カルボキシ基、
- 20 (d) ハロゲン原子、
- (e) C₁₋₃ アルキル基、
- (f) C₁₋₄ ハロアルキル基、
- (g) C₁₋₄ アルキルアミノ基、
- (h) ジ(C₁₋₄ アルキル) アミノ基、
- 25 (i) C₁₋₆ アルキルチオ基、
- (j) C₁₋₄ アルコキシ基、
- (k) C₁₋₄ アルキルカルボニル基及び
- (l) ハロゲン原子又はC₁₋₄ ハロアルキル基で置換されてもよいアリール基。

かかる置換基としては、好ましくは、(a) ヘテロ環基、(b) C₁₋₈ アルキル基、又は(c) ハロゲン原子又はC₁₋₄ ハロアルキル基で置換されてもよいアリール基である。

Zにおける「芳香族ヘテロ環基」上の置換基である「C₁₋₄ アルキル基

又はC₁₋₄アルキルカルボニル基で置換されてもよい「ヘテロ環基」における「ヘテロ環基」は、好ましくは、「窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択される1～3個のヘテロ原子を含有する飽和又は不飽和の5～7員ヘテロ環基」であり、具体的には、フリル基、チエニル基、
5 ピロリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、ピラゾリル基、ピリジル基、ピリダジニル基、ピリミジニル基、ピラジニル基、テトラヒドロフリル基、テトラヒドロチエニル基、ピロリジニル基、ピラゾリジニル基、イミダゾリジニル基、オキサゾリジニル基、チアゾリジニル基、テトラヒドロピ
10 ラニル基、ジオキサニル基、ピペリジニル基、ピペラジニル基、モルホリニル基等が挙げられる。好ましくはピペリジニル基、モルホリニル基、ピペラジニル基、ピロリジニル基、ピロリル基、テトラヒドロピラニル基である。

当該「ヘテロ環基」上の置換基としては、好ましくは、C₁₋₄アルキル
15 基又はC₁₋₄アルキルカルボニル基である。

Zにおける「芳香族ヘテロ環基」上の置換基である「水酸基、オキシ
基、ハロゲン原子又はC₁₋₆アルキル基で置換されてもよいC₃₋₇シクロアルキル基」における「C₃₋₇シクロアルキル」は、好ましくはシクロペン
チル基又はシクロヘキシル基であり、より好ましくはシクロヘキシル基
20 である。当該「C₃₋₇シクロアルキル基」は、水酸基、オキシ基、ハロゲン原子及びC₁₋₆アルキル基からなる群より選択される1乃至5個（好ましくは1乃至3個）の置換基で置換されていてもよい。当該「C₃₋₇シクロアルキル基」上の置換基としては、好ましくは、ハロゲン原子又はC₁₋₄アルキル基である。

25 Zにおける「芳香族ヘテロ環基」上の置換基である「ハロゲン原子」としては、前記定義の「ハロゲン原子」が挙げられ、好ましくは、フッ素原子、塩素原子又は臭素原子であり、特に好ましくは、塩素原子である。

Zにおける「芳香族ヘテロ環基」上の置換基である「C₁₋₈アルキル
30 基」としては、前記定義の「C₁₋₈アルキル基」が挙げられる。好ましくは、イソプロピル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、イソペンチル基、ネオペンチル基、tert-ペンチル基、1

ーエチルプロピル基、1-プロピルブチル基であり、より好ましくは、イソペンチル基、ネオペンチル基、tert-ペンチル基、1-エチルプロピル基、1-プロピルブチル基であり、特に好ましくは、ネオペンチル基、1-エチルプロピル基、1-プロピルブチル基である。

- 5 Zにおける「芳香族ヘテロ環基」上の置換基である「C₁₋₄ハロアルキル基」としては、前記定義の「C₁₋₄ハロアルキル基」が挙げられ、好ましくは、トリフルオロメチル基である。

- Zにおける「芳香族ヘテロ環基」上の置換基である「C₁₋₄アルキルアミノ基」としては、前記定義の「C₁₋₄アルキルアミノ基」が挙げられ、
10 好ましくは、メチルアミノ基、エチルアミノ基又はイソプロピルアミノ基である。

- Zにおける「芳香族ヘテロ環基」上の置換基である「ジ(C₁₋₄アルキル)アミノ基」としては、前記定義の「ジ(C₁₋₄アルキル)アミノ基」が挙げられ、好ましくは、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基又はジ
15 プロピルアミノ基である。

Zにおける「芳香族ヘテロ環基」上の置換基である「C₁₋₆アルキルチオ基」としては、前記定義の「C₁₋₆アルキルチオ基」が挙げられ、好ましくは、イソペンチルチオ基である。

- Zにおける「芳香族ヘテロ環基」上の置換基である「C₁₋₄アルコキシ
20 基」としては、前記定義の「C₁₋₄アルコキシ基」が挙げられる。

Zにおける「芳香族ヘテロ環基」上の置換基である「C₁₋₄アルキルカルボニル基」としては、前記定義の「C₁₋₄アルキルカルボニル基」が挙げられ、好ましくは、アセチル基である。

- Zにおける「芳香族ヘテロ環基」上の置換基である「ハロゲン原子又
25 はC₁₋₄ハロアルキル基で置換されてもよいアリール基」は、好ましくは、「ハロゲン原子又はC₁₋₄ハロアルキル基で置換されてもよいフェニル基」である。

Zにおける「ピペラジニル基」は、次の中から選択される1乃至5個（好ましくは1乃至3個）の置換基で置換されてもよい。

- 30 (a)フェニル基、
(b)フェニルC₁₋₄アルキル基、
(c)ハロゲン原子で置換されてもよいベンゾイル基及び

(d) フェニル C_{1-4} アルコキシカルボニル基。

Z における「ピペラジニル基」上の置換基である「フェニル C_{1-4} アルキル基」は、「アルキル部分」として前記定義の「 C_{1-4} アルキル基」を有するフェニルアルキル基であり、具体的には、ベンジル基、フェネチル基、1-フェニルエチル基、3-フェニルプロピル基等が挙げられる。好ましくは、ベンジル基である。

Z における「ピペラジニル基」上の置換基である「ハロゲン原子で置換されてもよいベンゾイル基」は、好ましくは1乃至5個の上記定義の「ハロゲン原子」で置換されてもよいベンゾイル基であり、具体的には、クロロベンゾイル基、プロモベンゾイル基等が挙げられる。

Z における「ピペラジニル基」上の置換基であるフェニル C_{1-4} アルコキシカルボニル基は、「アルコキシ部分」として前記定義の「 C_{1-4} アルコキシ基」を有するフェニルアルコキシカルボニル基であり、具体的には、ベンジルオキシカルボニル基等が挙げられる。好ましくは、ベンジルオキシカルボニル基である。

一般式 [I] において、好ましい態様は次のとおりである。

V は、 $=N-$ 又は $=CH-$ が好ましい。

W は、 $-S-$ が好ましい。

m は、1又は2が好ましい。

20 R^1 及び R^2 は、水素原子が好ましい。

X は、以下の(1)乃至(4)が好ましい。

(1)

$-N(R^4)-$ 、 $-SO_2-N(R^5)-$ 、 $-CO-N(R^7)-$ 若しくは $-O-$

25 (式中、 R^4 は水素原子又は C_{1-6} アルキル基を示し、 R^5 は水素原子又は C_{1-6} アルキル基を示し、 R^7 は水素原子又は C_{1-6} アルキル基を示す)、

(2)

$-N(R^4)-$

(式中、 R^4 は

30 (a) ハロゲン原子、 C_{1-8} アルキル基及び C_{1-4} ハロアルキル基からなる群より選択される1乃至3個の置換基で置換されてもよいアリール基、

(b) 1乃至3個の C_{1-8} アルキル基で置換されてもよい芳香族ヘテロ環

基、

(c) カルボキシ基、

(d) C_{1-4} アルコキシカルボニル基、

(e) $-CO-N(R^{15})(R^{16})$

- 5 (式中、 R^{15} 及び R^{16} は、それぞれ独立して、水素原子、アリール基 (当該アリール基は C_{1-8} アルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、カルボキシ基及びジ (C_{1-4} アルキル) アミノ基からなる群より選択される 1 乃至 3 個の置換基で置換されていてもよい)、芳香族ヘテロ環基、 C_{1-6} アルキル基 (当該 C_{1-6} アルキル基はアリール基で置換されていてもよい) を示すか、又は
- 10 はそれらが結合する窒素原子と一緒に、さらに窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択される少なくとも 1 つのヘテロ原子を含有してもよい 5 乃至 7 員ヘテロ環を形成してもよい)、

(f) $-N(R^{15})(R^{16})$

- (式中、 R^{15} 及び R^{16} は、それぞれ独立して、水素原子又はアリール基を示す)、
- 15

(g) $-O-R^{17}$

(式中、 R^{17} はアリール基を示す) 又は

(h) C_{3-7} シクロアルキル基

で置換された C_{1-6} アルキル基を示す)、

- 20 (3)

$-N(R^4)-$

(式中、 R^4 は

(a) $-CO-N(R^{15})(R^{16})$

- (式中、 R^{15} 及び R^{16} は、それぞれ独立して、水素原子、アリール基 (当該アリール基は 1 乃至 3 個の C_{1-8} アルキル基で置換されていてもよい)、 C_{1-6} アルキル基を示すか、又はそれらが結合する窒素原子と一緒に、インドリン環を形成してもよく、若しくはさらに窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択される少なくとも 1 つのヘテロ原子を含有してもよい 5 乃至 7 員ヘテロ環を形成してもよい)、
- 25

- 30 (b) $-SO_2-N(R^{15})(R^{16})$

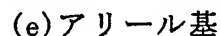
(式中、 R^{15} 及び R^{16} は、それぞれ独立して、アリール基又は C_{1-6} アルキル基を示す)、



(式中、 R^{17} はアリール基 (当該アリール基は C_{1-8} アルキル基及び C_{1-4} アルコキシ基からなる群より選択される 1 乃至 3 個の置換基で置換されていてもよい)、芳香族ヘテロ環基又は C_{1-6} アルキル基 (当該 C_{1-6} アルキル基は、ハロゲン原子及び C_{1-8} アルキル基から選択される 1 乃至 3 個の置換基で置換されてもよいアリール基、芳香族ヘテロ環基、アリール基で置換されてもよい C_{1-4} アルコキシ基又は 1 乃至 3 個の C_{1-8} アルキル基で置換されてもよいアリールオキシ基で置換されていてもよい) を示す)、

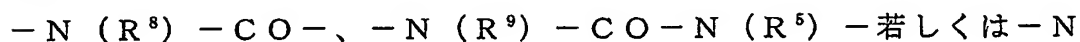


10 (式中、 R^{17} はアリール基を示す) 又は



を示す) 又は

(4)



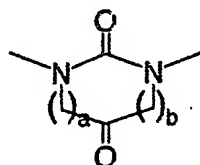
15 $(R^{10})-(CH_2)_k-N(R^5)-$

(式中、

R^5 は水素原子又はアリール基で置換されてもよい C_{1-6} アルキル基を示し、

R^8 は水素原子又は C_{1-6} アルキル基を示し、

R^9 は R^5 と一緒になって

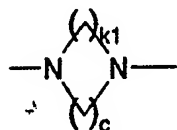


20

(式中、 a 及び b は、それぞれ独立して、0、1 又は 2 を示す) を形成し、

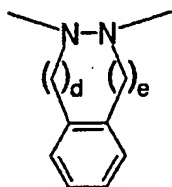
k は 0 又は 1 乃至 4 の整数を示し、

R^{10} は R^5 と一緒になって



25

(式中、 k_1 及び c は、それぞれ独立して、0 又は 1 乃至 4 の整数を示す) 又は



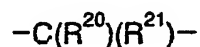
(式中、 d 及び e は、それぞれ独立して、0、1 又は 2 を示す) を形成する)。

n は、0 又は 1 乃至 3 の整数が好ましい。

p は、0 又は 1 が好ましい。

L は、以下の (1) 乃至 (4) が好ましい。

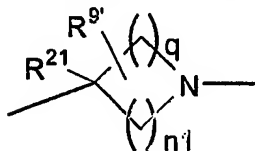
(1)



10

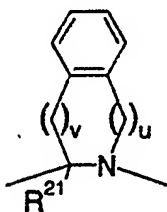
(式中、

R^{20} は R^4 と一緒になって



(式中、 n_1 及び q は、それぞれ独立して、0 又は 1 乃至 4 の整数を示し、

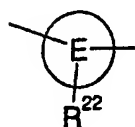
15 $R^{9'}$ は、水素原子、水酸基、 C_{1-6} アルキル基、カルボキシ基又は C_{1-6} アルコキシ基を示す) 又は



(式中、 u 及び v は、それぞれ独立して、0、1 又は 2 を示す) を形成し、

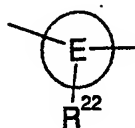
20 R^{21} は水素原子を示す)、

(2)



(式中、Eはフェニル基、フリル基、イソオキサゾリル基又はピリジル基を示し、 R^{22} は水素原子を示す)、

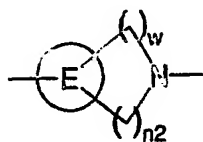
(3)



5

(式中、
Eはフェニル基を示し、
 R^{22} は

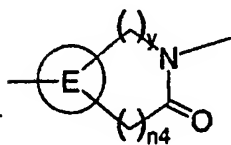
(a) R^1 と一緒にになって



10

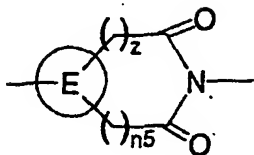
(式中、 n_2 及び w は、それぞれ独立して、0又は1乃至3の整数を示す)を形成するか、

(b) R^1 と一緒にになって



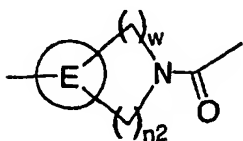
15 (式中、 n_4 及び y は、それぞれ独立して、0、1又は2を示す)を形成するか、

(c) R^1 と一緒にになって



(式中、 n_5 及び z は、それぞれ独立して、0 又は 1 を示す) を形成するか、又は

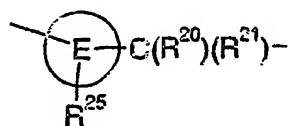
(d) R^8 と一緒になって



5

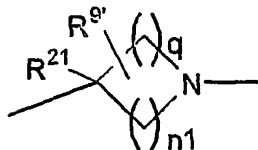
(式中、 n_2 及び w は、それぞれ独立して、0 又は 1 乃至 3 の整数を示す) を形成する) 又は

(4)



10 (式中、

R^{20} は R^4 と一緒になって



(式中、 n_1 及び q は、それぞれ独立して、0 又は 1 乃至 4 の整数を示し、 $R^{9'}$ は、水素原子、水酸基、 C_{1-6} アルキル基、カルボキシ基又は C_{1-6} アルコキシ基を示す) を形成し、

15

R^{21} は水素原子を示し、

E はフェニル基、フリル基、イソオキサゾリル基又はピリジル基を示し、 R^{25} は水素原子を示す)。

R は、 $-COO(R^{19})$ 、 $-A^1-COO(R^{19})$ 又は $-O-A^1-COO(R^{19})$

20

(式中、 A^1 は C_{1-4} アルキレン基を示し、 R^{19} は水素原子又は C_{1-4} アルキ

ル基を示す)が好ましい。

Bは、フェニル基か、又は芳香族ヘテロ環基(当該芳香族ヘテロ環基は、チエニル基、チアゾリル基、ピラゾリル基、1, 3, 4-チアジアゾリル基、ピリジル基、ピリダジニル基、ピリミジニル基、インドリル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾチアゾリル基及びベンゾオキサゾリル基からなる群より選択される)が好ましい。

Bは、Vが=CH-である場合には、当該VがWと一緒に構成するチオフエン又はフラン環上において、Bの置換位置が4位又は5位であるのが好ましく、Vが=N-である場合には、当該VがWと一緒に構成するチアゾール又はオキサゾール環上において、Bの置換位置が4位であるのが好ましい。

R³は、水素原子が好ましい。

Yは、-C(R¹³)(R¹⁴)-N(R¹²)-、-C(R¹³)(R¹⁴)-O-、-N(R¹¹)-又は-O-
(式中、R¹¹は水素原子又はC₁₋₈アルキル基を示し、R¹²は水素原子又はC₁₋₈アルキル基を示し、R¹³及びR¹⁴はともに水素原子を示す)が好ましい。

sは、0又は1が好ましい。

Aは、メチレン基が好ましい。

Y、s及びAは、以下の(1)又は(2)であるのが好ましい。

(1)

Yが-C(R¹³)(R¹⁴)-N(R¹²)-若しくは-C(R¹³)(R¹⁴)-O-

(式中、R¹²は水素原子又はC₁₋₈アルキル基を示し、R¹³及びR¹⁴はともに水素原子を示す)、

且つ

sが0。

(2)

Yが-N(R¹¹)-若しくは-O-

(式中、R¹¹は水素原子又はC₁₋₈アルキル基を示す)、

且つ

sが1、Aがメチレン基。

Zは、

(a)ハロゲン原子及びC₁₋₆アルキル基からなる群より選択される1乃至3の置換基で置換されてもよいC₃₋₇シクロアルキル基、

(b)ハロゲン原子、

5 (c)C₁₋₈アルキル基、

(d)C₁₋₄ハロアルキル基、

(e)ジ(C₁₋₄アルキル)アミノ基、

(f)C₁₋₆アルキルチオ基及び

(g)C₁₋₄アルキルカルボニル基

10 からなる群より選択される置換基で置換されたアリール基が好ましい。

Zは、C₁₋₈アルキル基（当該C₁₋₈アルキル基は、イソプロピル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、イソペンチル基、ネオペンチル基、tert-ペンチル基、1-エチルプロピル基及び1-プロピルブチル基からなる群より選択される）で置換されたフェニル

15 基がより好ましい。

Zは、1-エチルプロピル基又は1-プロピルブチル基で置換されたフェニル基が特に好ましい。

一般式〔I〕において、特に好ましい態様は次のとおりである。

Vは、=N-又は=CH-が特に好ましい。

20 Wは、-S-が特に好ましい。

mは、1が特に好ましい。

R¹及びR²は、水素原子が特に好ましい。

X、n、p及びLは、以下の(1)乃至(7)が特に好ましい。

(1)

25 Xが-N(R⁴)-

(式中、R⁴は1乃至3個のC₁₋₈アルキル基で置換されてもよい芳香族ヘテロ環基で置換されたC₁₋₈アルキル基を示す)

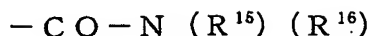
且つ

nが1、pが0。

30 (2)

Xが-N(R⁴)-

(式中、R⁴は



- (式中、 R^{15} 及び R^{16} は、それぞれ独立して、水素原子、アリール基 (当該アリール基は C_{1-8} アルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、カルボキシ基及びジ (C_{1-4} アルキル) アミノ基からなる群より選択される 1 乃至 3 個の置換基で置換されていてもよい)、芳香族ヘテロ環基、 C_{1-6} アルキル基 (当該 C_{1-6} アルキル基はアリール基で置換されていてもよい) を示すか、又はそれらが結合する窒素原子と一緒に、さらに窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択される少なくとも 1 つのヘテロ原子を含有してもよい 5 乃至 7 員ヘテロ環を形成してもよい) で置換された C_{1-6} アルキル基を示す)

且つ

n が 1、 p が 0。

(3)



- 15 (式中、 R^4 は $-\text{CO}-\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$)

- (式中、 R^{15} 及び R^{16} は、それぞれ独立して、水素原子、アリール基 (当該アリール基は 1 乃至 3 個の C_{1-6} アルキル基で置換されていてもよい)、 C_{1-6} アルキル基を示すか、又はそれらが結合する窒素原子と一緒に、インドリン環を形成してもよく、若しくはさらに窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択される少なくとも 1 つのヘテロ原子を含有してもよい 5 乃至 7 員ヘテロ環を形成してもよい) を示す)

且つ

n が 1、 p が 0。

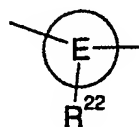
(4)

- 25 X が $-\text{N}(\text{R}^4) -$ 、 $-\text{SO}_2-\text{N}(\text{R}^5) -$ 、 $-\text{CO}-\text{N}(\text{R}^7) -$ 又は $-\text{O}-$

(式中、 R^4 は水素原子又は C_{1-6} アルキル基を示し、 R^5 は水素原子又は C_{1-6} アルキル基を示し、 R^7 は水素原子又は C_{1-6} アルキル基を示す)、

且つ

- 30 n が 0、 p が 1、 L が



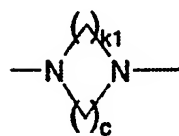
(式中、Eはピリジル基を示し、 R^{22} は水素原子を示す)。

(5)

Xが $-N(R^{10})-(CH_2)_k-N(R^5)-$

5 (式中、kは0又は1乃至4の整数を示し、

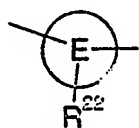
R^{10} は R^5 と一緒にあって



(式中、 k_1 及びcは、それぞれ独立して、0又は1乃至4の整数を示す)を形成する)、

10 且つ

nが0又は1乃至4の整数、pが1、Lが



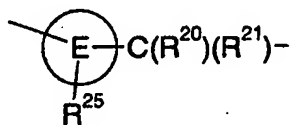
(式中、Eはフェニル基、フリル基、イソオキサゾリル基又はピリジル基を示し、 R^{22} は水素原子を示す)。

15 (6)

Xが $-N(R^4)-$

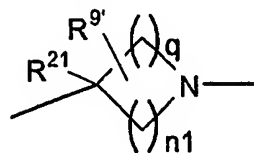
且つ

nが0又は1乃至4の整数、pが1、Lが



20 (式中、

R^{20} は R^4 と一緒にあって



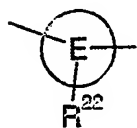
- (式中、 $n1$ 及び q は、それぞれ独立して、0 又は 1 乃至 4 の整数を示し、 $R^{9'}$ は、水素原子、水酸基、 C_{1-6} アルキル基、カルボキシ基又は C_{1-6} アルコキシ基を示す) を形成し、
 5 R^{21} は水素原子を示し、
 E はフェニル基、フリル基、イソオキサゾリル基又はピリジル基を示し、
 R^{26} は水素原子を示す)。

(7)

- 10 X が $-N(R^4)-$

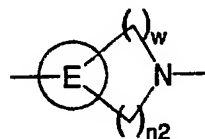
且つ

n が 0 又は 1 乃至 3 の整数、 p が 1、 L が



(式中、

- 15 E はフェニル基を示し、
 R^{22} は R^4 と一緒にあって



(式中、 $n2$ 及び w は、それぞれ独立して、0 又は 1 乃至 3 の整数を示す) を形成する)。

- 20 R は、 $-COO(R^{19})$

(式中、 R^{19} は水素原子又は C_{1-4} アルキル基を示す) が特に好ましい。

B は、フェニル基が特に好ましい。

B は、 V が $=CH-$ である場合には、当該 V が W と一緒にあって構成するチオフェン又はフラン環上において、 B の置換位置が 4 位又は 5 位

であるのが好ましく、Vが=N-である場合には、当該VがWと一緒に
なって構成するチアゾール又はオキサゾール環上において、Bの置換位
置が4位であるのが特に好ましい。

R³は、水素原子が特に好ましい。

- 5 Y、s及びAは、以下の(1)又は(2)であるのが特に好ましい。

(1)

Yが-C(R¹³)(R¹⁴)-N(R¹²)-若しくは-C(R¹³)(R¹⁴)-O-

- 10 (式中、R¹²は水素原子又はC₁₋₈アルキル基を示し、R¹³及びR¹⁴はとも
に水素原子を示す)、

且つ

sが0。

(2)

Yが-N(R¹¹)-若しくは-O-

- 15 (式中、R¹¹は水素原子又はC₁₋₈アルキル基を示す)、

且つ

sが1、Aがメチレン基。

Zは、1-エチルプロピル基又は1-プロピルブチル基で置換された
フェニル基が特に好ましい。

- 20 一般式[I I]において、好ましい態様は以下のとおりである。

Vは、=CH-が好ましい。

Wは、-S-が好ましい。

Y¹⁰⁰は、-CH₂-が好ましい。

R¹⁰⁰は、水酸基又は塩素原子が好ましい。

- 25 Bは、フェニル基が好ましい。

Bは、VとWとが一緒になって構成するチオフェン環上において、B
の置換位置が4位であるのが好ましい。

R³は、水素原子が好ましい。

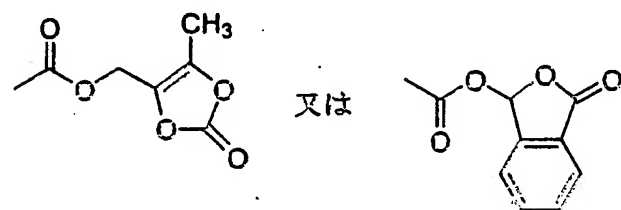
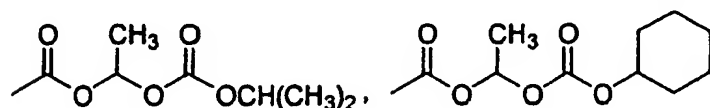
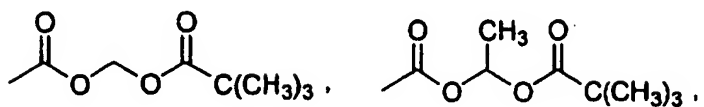
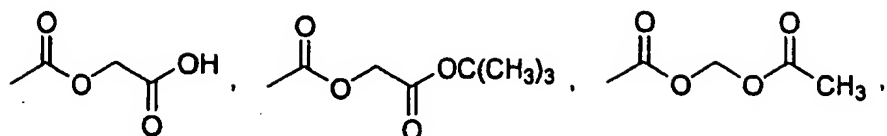
- 30 「医薬上許容し得る塩」とは、上記一般式[I]で示される化合物と
無毒の塩を形成するものであればいかなる塩でもよく、例えば、塩酸、
硫酸、リン酸、臭化水素酸等の無機酸；又はシュウ酸、マロン酸、クエ
ン酸、フマル酸、乳酸、リンゴ酸、コハク酸、酒石酸、酢酸、トリフル

- オロ酢酸、グルコン酸、アスコルビン酸、メチルスルホン酸、ベンジル
スルホン酸等の有機酸；又は水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸
化カルシウム、水酸化マグネシウム、水酸化アンモニウム等の無機塩
基；又はメチルアミン、ジエチルアミン、トリエチルアミン、トリエタ
5 ノールアミン、エチレンジアミン、トリス（ヒドロキシメチル）メチル
アミン、グアニジン、コリン、シンコニン、N-メチル-D-グルカミ
ン等の有機塩基；又はリジン、ヒスチジン、アルギニン、アラニン等の
アミノ酸と反応させることにより得ることができる。なお、本発明にお
いては各化合物の含水物或るいは水和物及び溶媒和物も包含される。
- 10 また、上記一般式〔I〕で示される化合物においては、種々の異性体
が存在する。例えば、幾何異性体としてE体及びZ体が存在し、また、
不斉炭素原子が存在する場合は、これらに基づく立体異性体としての鏡
像異性体及びジアステレオマーが存在する。場合によっては互変異性体
が存在し得る。従って、本発明の範囲にはこれらすべての異性体及びそ
15 れらの混合物が包含される。

なお、本発明においては一般式〔I〕で示される化合物のプロドラッグ
及び代謝物も包含される。

- 「プロドラッグ」とは、化学的又は代謝的に分解し得る基を有し、生
体に投与された後、元の化合物に復元して本来の薬効を示す本発明化合
20 物の誘導体であり、共有結合によらない複合体及び塩を含む。

例えば、医薬の分野においてプロドラッグとして公知のエステル誘導
体を使用することができる。具体的には、Rにおける-COOR'部分が
以下の式で表される基を示すエステル誘導体が挙げられる。



- 本発明化合物を医薬製剤として用いる場合、通常それ自体公知の製薬上許容される担体、賦形剤、希釈剤、増量剤、崩壊剤、安定剤、保存剤、
 5 緩衝剤、乳化剤、芳香剤、着色剤、甘味剤、粘稠剤、矯味剤、溶解補助剤、その他添加剤、具体的には水、植物油、エタノール又はベンジルアルコール等のアルコール、ポリエチレングリコール、グリセロールトリアセテート、ゼラチン、ラクトース、デンプン等の炭水化物、ステアリン酸マグネシウム、タルク、ラノリン、ワセリン等と混合して、常法に
 10 より錠剤、丸剤、散剤、顆粒、坐剤、注射剤、点眼剤、液剤、カプセル剤、トローチ剤、エアゾール剤、エリキシル剤、懸濁剤、乳剤、シロップ剤等の形態となすことにより、全身的或いは局所的に、経口若しくは非経口で投与することができる。

- 本発明化合物の投与量は年齢、体重、症状、治療すべき疾患、投与方法等により異なるが、通常、成人ひとり当たり、1回に1mg乃至1,
 15

0.00 mg の範囲で、1 日 1 回乃至数回が投与される。

本発明の化合物 [I] は、PTP1B 阻害剤、受容体型チロシンキナーゼネガティブ調節因子阻害剤、糖尿病の予防又は治療薬、糖尿病合併症（網膜症、腎症、神経障害、シンドローム X 若しくはメタボリックシンドローム、虚血性心疾患（心筋梗塞、狭心症等）及び脳卒中（脳梗塞、脳出血、くも膜下出血等）の予防又は治療薬、高脂血症の予防又は治療薬、肥満症の予防又は治療薬、神経変性疾患（黄斑浮腫、黄斑変性症等）等の予防又は治療薬、PTP1B の介在する疾患の予防又は治療薬として、哺乳動物（ヒト、マウス、ラット、ウサギ、イヌ、ネコ、ウシ、ブタ、サル等）に投与することができる。

本発明の化合物 [I] は、優れた選択的 PTP1B 阻害作用を有する。「優れた選択的 PTP1B 阻害作用」とは、PTP1B 阻害活性が他の蛋白質チロシンホスファターゼ（例えば、T 細胞蛋白質チロシンホスファターゼ (TCPTP; T-Cell Protein Tyrosine Phosphatase)) 阻害活性と比較して強いことをいい、具体的には、例えば、PTP1B に対する IC_{50} が TCPTP に対する IC_{50} よりも 1/10 以下の低値を示すことであり、その場合、より好ましくは 1/60 以下であり、特に好ましくは 1/300 以下である。したがって、本発明の化合物 [I] は、副作用の少ない PTP1B 阻害剤、受容体型チロシンキナーゼネガティブ調節因子阻害剤、糖尿病の予防又は治療薬、糖尿病合併症の予防又は治療薬、高脂血症の予防又は治療薬、肥満症、神経変性疾患等の予防又は治療薬、PTP1B の介在する疾患の予防又は治療薬として使用することができる。

「受容体型チロシンキナーゼネガティブ調節因子阻害剤」とは、リガンドとの結合による受容体型チロシンキナーゼの活性化に端を発する細胞内のシグナル伝達をネガティブ方向に調節する因子を阻害して、結果当該シグナルを増強させる作用を有する薬剤をいう。例えば、受容体型チロシンキナーゼの一つであるインスリン受容体の場合には、インスリンとの結合により受容体が活性化されて受容体それ自体の細胞内領域、IRS（インスリンレセプターサブストレート）等がリン酸化され、グルコースの取り込みを引き起こす細胞内のシグナル伝達が起こり、かかるシグナル伝達をネガティブ方向に調節する因子を阻害する薬剤が受容

体型チロシンキナーゼネガティブ調節因子阻害剤であり、その代表的な例として P T P 1 B 阻害剤が挙げられる。受容体型チロシンキナーゼネガティブ調節因子阻害剤は、既存のインスリン感受性増強剤（チアゾリジンジオン誘導体等の P P A R 作動剤）とは異なる。すなわち、P T P 1 B 阻害剤に代表されるように、受容体型チロシンキナーゼネガティブ調節因子阻害剤は、インスリンが惹起する細胞内シグナルに直接作用することから、既存のインスリン感受性増強剤の投与では有効性が充分でない哺乳動物（非肥満型糖尿病患者等）に対しても高い有効性が期待でき、また、既存のインスリン感受性増強剤が有する副作用の回避も期待できる。

本発明の化合物 [I] は、糖尿病又は糖尿病合併症（特に、細小血管合併症、すなわち、網膜症、腎症、神経障害等）の予防又は治療の目的で、他の糖尿病治療薬と組み合わせて使用し、哺乳動物に併用投与することができる。本発明において、「糖尿病治療薬」には、糖尿病合併症（特に、細小血管合併症）の治療薬も含まれる。また、本発明の化合物 [I] は、高脂血症の予防又は治療の目的で、他の高脂血症治療薬と組み合わせて使用し、哺乳動物に併用投与することができる。さらに、本発明の化合物 [I] は、肥満症の予防又は治療の目的で、他の肥満症治療薬と組み合わせて使用し、哺乳動物に併用投与することができる。

さらに、本発明の化合物 [I] は、糖尿病合併症（特に、大動脈合併症、すなわち、シンドローム X 又はメタボリックシンドローム、虚血性心疾患（心筋梗塞や狭心症等）や脳卒中（脳梗塞、脳出血やくも膜下出血等）等）の予防又は治療の目的で、糖尿病治療薬、高脂血症治療薬、肥満症治療薬、高血圧症治療薬及び／又は血栓症治療薬と組み合わせて使用し、哺乳動物に併用投与することができる。

糖尿病治療薬、高脂血症治療薬、肥満症治療薬、高血圧症治療薬又は血栓症治療薬（以下、併用医薬という）と組み合わせて使用する場合、本発明の化合物は、併用医薬と同時に投与しても、時間間隔をおいて投与してもよい。併用医薬と組み合わせて使用する場合、本発明の化合物と併用医薬を含有する医薬組成物として投与することができる。又は、本発明の化合物を含有する医薬組成物と、併用医薬を含有する医薬組成物を、別々に投与してもよい。各医薬組成物の投与経路は同一であって

も異なっているもよい。

併用医薬と組み合わせて使用する場合、その併用医薬が本発明の化合物と異なる作用機序を有する場合（例えば、インスリン分泌促進剤、ビッグアナイド剤、 α -グルコシダーゼ阻害剤、インスリン製剤、インスリン感受性増強剤、PTP1B阻害剤以外の受容体型チロシンキナーゼネガティブ調節因子阻害剤等）であれば、本発明の化合物と併用医薬それぞれの作用に基づく相加的な予防又は治療の効果が得られるのみならず、両者の作用を組み合わせた結果増幅された予防又は治療の効果を示すことも期待できる。それゆえ、本発明の化合物及び併用医薬のそれぞれの場合において、単独で投与した場合と比較して、より少ない量の投与で高い有効性が期待でき、また、単独で投与した場合には回避できない副作用を解決することも期待できる。したがって、本発明の化合物は、1回に1mg乃至1,000mgの範囲の投与量で、1日1回乃至数回投与することができ、又は、より少ない投与量で投与してもよい。併用医薬は、それらが糖尿病若しくは糖尿病合併症の予防若しくは治療、高脂血症の予防若しくは治療、又は肥満症の予防若しくは治療に使用される場合の通常の投与量で投与することができ、又は、より少ない投与量で投与してもよい。

併用医薬として使用される糖尿病治療薬としては、インスリン分泌促進剤（ATP依存性カリウム（K(ATP))チャネル阻害剤（スルホニルウレア剤、スルホンアミド剤、フェニルアラニン誘導体等））、ビッグアナイド剤、 α -グルコシダーゼ阻害剤、インスリン製剤、インスリンアナログ、インスリン感受性増強剤（チアゾリジンジオン誘導体（グリタゾン）等のペルオキシソーム増殖因子活性化受容体（PPAR） γ 作動剤）、IL-11、抗CD25（IL-2受容体）剤（モノクローナル抗体等）、アンギオテンシン(AT1)拮抗剤、アンギオテンシン変換酵素（ACE）阻害剤、アルドースレダクターゼ阻害剤、抗酸化剤（プロテインキナーゼ活性化剤/逆転写阻害剤）、カルニチンアセチルトランスフェラーゼ刺激剤、抗鬱剤、グルココルチコイド、レチリン、ラジカル形成作動剤及びトランスケトラーゼ活性化剤が挙げられる。また、 β 3-アドレナリン受容体作動剤、インスリン感受性増強剤、核受容体調節剤、ペルオキシソーム増殖因子活性化受容体、PPAR α 作動剤、PPAR γ 拮抗剤、PPAR δ リガンド（作動剤または拮抗剤）、フ

- イブラート、レチノイド受容体に作用する薬剤(レチノイド等)、タンパク質チロシンホスファターゼ(PTP)阻害剤(本発明化合物以外)、タンパク質チロシンホスファターゼ-1B (PTP1B)阻害剤(本発明化合物以外)、T-細胞タンパク質チロシンホスファターゼ(TCPTP)阻害剤(本発明化合物以外)、
- 5 白血球共通抗原関連タンパク質(LAR)阻害剤、SH2 含有イノシトールホスファターゼ 2(SHIP2)阻害剤、c-JunNH2 末端キナーゼ(JNK)阻害剤、インスリン受容体作動剤、インスリン受容体キナーゼ刺激剤、インスリン様成長因子(IGF)-1 拮抗剤、ジペプチジルペプチダーゼ IV 阻害剤、グルカゴン様ペプチド 1 (GLP1)作動剤、GLP1、レプチン、ATP 依存性カリウム
- 10 チャンネル活性化剤; VPAC2 (血管作動性腸管ペプチド(VIP)の受容体)作動剤、P2Y 作動剤; β アミロイドタンパク質拮抗剤、アポトーシス阻害剤、TGR79 作動剤、GPR40 作動剤、ナトリウム-グルコース共輸送体阻害剤(SGLT-2 阻害剤等)、グリコーゲンホスホリラーゼ阻害剤、フルクトース-6-ホスファターゼ阻害剤、ホスホエノールピルビン酸カルボキシキナーゼ(PEPCK)阻害剤、ピルビン酸デヒドロゲナーゼキナーゼ阻害剤、グル
- 15 コース-6-ホスファターゼ阻害剤、グリコーゲンシンターゼキナーゼ(GSK)-3 阻害剤、グルコキナーゼ活性化剤、グルカゴン拮抗剤、シグナルトランスデューサー及び転写活性化剤(STAT)-3 調節剤、フォークヘッド転写因子(FOXO-1)阻害剤、IL-10 作動剤及び IL-4 作動剤等のインターロ
- 20 イキン(IL)作動剤、IL-6 産生阻害剤、腫瘍壊死因子(TNF)- α 産生阻害剤、単球走化性因子タンパク質(MCP)-1 発現阻害剤、アディポサイトカイン調節剤、プラスミノゲン活性化剤阻害剤 1 型(PAI-1)産生阻害剤、アディポネクチン産生増強剤、アディポネクチン受容体作動剤、アディポネクチン、レジスチン産生阻害剤、レジスチン受容体拮抗剤、 α 2-アドレ
- 25 ナリン受容体拮抗剤、 β 2-アドレナリン受容体拮抗剤、5-HT6 拮抗剤、セリンカルボキシペプチダーゼ阻害剤、ATP-結合カセット A1(ABCA1)発現増強剤、レチノイド X 受容体(RXR)作動剤、肝臓 X 受容体(LXR)リガンド(作動剤または拮抗剤)、アディポサイト脂肪酸結合タンパク質(FABP)(aP2)阻害剤、コレステロール拮抗剤、アデノシン A2B 拮抗剤、 α 1-アド
- 30 レナリン受容体作動剤、 α 2-アドレナリン受容体、カルニチンO-パルミトイルトランスフェラーゼ阻害剤、AMP 活性化プロテインキナーゼ(AMPK)活性化剤、グルコース輸送体(GLUT)-4 転座活性化剤、グルココ

- ルチコイド受容体拮抗剤、グルココルチコイド受容体調節剤、 11β -ヒドロキシステロイドデヒドロゲナーゼ阻害剤、成長ホルモン放出阻害剤、ソマトスタチンアナログ、ソマトスタチン sst5 作動剤、ソマトスタチン sst2 作動剤、成長ホルモン-放出因子 (GHRF)、グレリン産生阻害剤、グレ
- 5 リン受容体拮抗剤、キナーゼ阻害剤、PTPN1 発現阻害剤 オリゴヌクレオチド、抗酸化剤、酸化窒素捕捉剤、フリーラジカル捕捉剤、ヘムオキシゲナーゼ (HO)-1 誘導因子、EGFR (erbB1) 阻害剤、ホスホジエステラーゼ III 阻害剤、ホスホジエステラーゼ IV 阻害剤、アセチル-CoA カルボキシ
- 10 ラーゼ (ACC) 阻害剤、カルニチンパルミトイルトランスフェラーゼ (CPT) 1 阻害剤、グルコースセンサー活性化剤、ミクロソームトリグリセリド転写タンパク質 (MTP) 阻害剤、ジアシルグリセロールアシルトランスフェラーゼ (DGAT) 阻害剤、スタチン、コレステロールエステル輸送タンパク質 (CETP) 阻害剤、任意の他のグルコース低減剤、抗 CD3 剤 (モノクローナル抗体等)、グルタミン酸デカルボキシラーゼ刺激剤、ガストリン及び上
- 15 皮成長因子 (EGF) の組み合わせ、カルシニューリン阻害剤、抗酸化剤 (メタロポルフィリン等)、 NAD^+ ADP-リボシルトランスフェラーゼ (ポリ (ADP-リボース) ポリメラーゼ; PARP) 阻害剤、免疫刺激剤、ケモカイン受容体作動剤、ケモカイン受容体拮抗剤、バナジウム錯体、p38 プロテイン
- 20 キナーゼ阻害剤、糖化最終産物 (AGE) 阻害剤 (メイラード反応阻害剤)、低分子量 (LMW) ヘパリン、誘導型酸化窒素シンターゼ阻害剤、抗血小板由来成長因子 (PDGF) 剤 (モノクローナル抗体等)、血管形成阻害剤 (アボト
- ーシス誘導因子、エンドセリン拮抗剤 (ETA) 等)、ソマトスタチン sst2 拮抗剤、成長因子調節剤、細胞接着阻害剤、アマドラーゼ阻害剤、形質転換成長因子 (TGF)- β 受容体拮抗剤、TGF- β 受容体シグナル阻害剤、TGF-
- 25 β 産生阻害剤、抗 TGF- β 抗体、抗 TGF- β 受容体抗体、抗レクチン様酸化低密度リポタンパク質受容体 (LOX)-1 剤 (モノクローナル抗体等)、Edge 受容体拮抗剤、Edge 受容体シグナル阻害剤、神経栄養因子増強剤、神経
- 栄養剤、神経成長因子 (NGF)、NGF 作動剤、血管内皮成長因子 (VEGF)、ニューロトロピン (NT)-3、NT-3 誘導因子、プロテインキナーゼ (PK) C β 阻
- 30 害剤、 γ -アミノ酪酸 (GABA) 媒介輸送に作用する薬剤、5-HT 再取り込み阻害剤、5-HT_{2A} 拮抗剤、ノルエピネフリン再取り込み阻害剤、バニロイド受容体に作用する薬剤、カンナビノイド受容体作動剤、IL-6、N-メチル-D-ア

スパラギン酸 (NMDA)拮抗剤、プロスタグランジン E1、プロスタサイクリンアナログ、ピルビン酸デヒドロゲナーゼ活性化剤、酸化窒素シンターゼ (NOS)3 発現増強剤、ヒートショックタンパク質一般的作動剤、ナトリウムチャンネル阻害剤、NAALADase 阻害剤、一般的ポンプ阻害剤、ソニックヘッジホッグ IgG、VEGF 受容体拮抗剤、VEGF 受容体シグナル阻害剤、色素上皮由来因子 (PEDF)、抗 VEGF モノクローナル抗体、マトリックスメタロプロテイナーゼ阻害剤、メチオニンアミノペプチダーゼ-2 阻害剤、ソマトスタチン sst1 作動剤、チロシンキナーゼ阻害剤、上皮成長因子拮抗剤、ビトロネクチン ($\alpha v \beta 3$ 、 $\alpha v \beta 5$ 等)拮抗剤、低酸素誘導性因子 (HIF)阻害剤、ニューロピリン-1 受容体拮抗剤、アンギオポエチン-2 受容体拮抗剤、アンギオポエチン-2 産生阻害剤、アンギオポエチン-1 受容体作動剤、アンギオポエチン-1 誘導因子等も挙げられる。例えば、ナテグリニド、グリメピリド、グリベンクラミド、グリクラジド、アセトヘキサミド、トルブタミド、グリクロピラミド、トラザミド、グリブゾール、グリピジド、グルボルヌリド、グリキドン、レパグリニド、塩酸メトホルミン、塩酸ブホルミン、ボグリボース、アカルボース、エパルレスデット、ミグリトール、インスリン、塩酸ピオグリタゾン、マレイン酸ロシグリタゾン、ピコリン酸クロム/ビオチン、V-411、組換えヒトインターロイキン-11、ダシリキシマブ (ダシリツマブ)、ロサルタンカリウム、カプトプリル、塩酸イミダプリル、 α -リボ酸、塩酸レバセカルニン (アセチル-L-カルニチン、アセチルレボカルニチン)、カプトプリル、レチリン、ベルテポルフィン、ベンフォチアミン及びフルオシノロンアセトニドが本発明の化合物の併用医薬として組み合わせて使用される。また、併用医薬としては、バラグリタゾン、リボグリタゾン、イサグリタゾン (ネトグリタゾン)、塩酸クリプトレピン、酢酸トリプロアミリン (プラムリンチド)、ミチグリニドカルシウム水和物、ムラグリタザール、テサグリタザール、オキセグリタザール、インスリングルリシン、インスリン デテミール、ヘキシルインスリンモノコンジュゲート 2、エアロドーズインスリン吸入薬、エアインスリン、テクノスフェア/インスリン、rDNA インスリン、他の吸入、経肺または経口ヒトインスリン、エクセンジン-4、スルホスチン、リラグルチド、組換えグルカゴン様ペプチド-1 (7-36)アミド (AC-2592)、デクスリボタム、サイクリボスチン R、ラミブ

リル、デヒドロトラメテノール酸、ファモキシム、メトキシム-3,4-デフ
オスタチン、デメチルアステリキノン B-1、アディポネクチン(ヒト)、サ
ラチノール、レボリン B、TAK-654、MBX-102、ADD-9918、ADD-9922、NN-
304、NN-344、BIM-51077、LABI (NN-1215)、SNAC/インスリン、LAF-237、
5 823093、825964、815541、P93/01、SSR-162329、LY-510929 (LY-929)、
LBL-752 (DRF-MDX8、DRF-4158)、GW-677954、LY-307161 SR、CJC-1131、
SUN-E7001、ZP-10A (AVE-0010)、MB-6322 (CS-917)、BVT-2498、INGAP ペ
プチド、LY-818、TH-9507、ISIS-113715、SR-58611、YM-178、SB-418790
(AZ-40140、GW-427353)、N-5984、NN-2501、RF-1051、HMR-1426、NOX-
10 700、ATL-962、869682、R-1439、R-765、GW-501516、GI-181771、ST-
1326、VDO-52、A-348441、BLX-1002、TLK-19781、ZYH-2、BLX-2001、NC-
1567、R-1440、(FMS)3-インスリン、インスリン鎖 B (9-23)ペプチド、ゲ
ナポール (Genapol) 安定化インスリン、インスリン経皮剤、メトレレブ
チン(組換えメチオニルヒトレプチン)、膝島新生療法、NBI-6024、NN-
15 344、O-346、DiaPep227 (AVE-0277)、TRX-4、rhGAD65、rhIGF-I
(rhIGFBP-3)、R-1524 (ISA-247、ISAtx-247)、TRX-4-TolerMab、MnTE-2-
Pyp5+ (AEOL-10113)、CTCM-226、イルベサルタン、テルミサルタン、カ
ンデサルタン シレキチル (ヘキセチル)、プラトサルタン、ピリドキサ
ミン(ピリドキシルアミン)、リソスペルミン酸 B マグネシウム (リソス
20 ペルミン酸 B マグネシウム塩)、スロデキシド、アミノグアニジン (ピマ
ゲジン)、ピルフェニドン、1D11、CR-002、T-8、(+)-A-127722 (A-
147627、ABT-627)、ED-4914、フィダレスタット、塩酸ネファゾドン、塩
酸ベンラファキシン、プレガバリン、メシル酸ルボキシスタウリン、組
換えヒト神経成長因子、カプサバニル、ドロナビノール/カンナビジオー
25 ル、アテキサキン α (インターロイキン-6)、塩酸メマンチン、デクスリ
ポタム、ベラプロストナトリウム、マレイン酸アリモクロモール、SX-
3201 (AS-3201、SX-3030)、TAK-428、QR-333、塩酸ルボキシスタウリン、
酢酸オクトレオチド、アミノグアニジン (ピマゲジン)、ペガブタニブオ
クタナトリウム、ヒアルロニダーゼ、セスカンデリン、バチマスタット、
30 組換えアンギオポエチン-1、LY-338522、BIM-23190、AdPEDF.11
(Ad(GV)PEDF.11D)、VEGF Trap (VEG Trap(R1R2))、CVT-3634 等も使用さ
れる。好ましくは、他の糖尿病治療薬には、インスリン、グリベンクラ

ミド、トルブタミド、ナテグリニド、塩酸メトホルミン、ボグリボース及び塩酸ピオグリタゾン等のインスリン製剤、インスリン分泌促進剤、ビッグアニド剤、 α -グルコシダーゼ阻害剤及びインスリン感受性増強剤が含まれる。

- 5 併用医薬として使用される高脂血症治療薬としては、HMG-CoA レダクターゼ阻害剤(スタチン)、フィブラート、TNFSF6 発現阻害剤、HDL-コレステロール増加剤、アポ A1 発現増強剤、SPP1 (オステオポンチン) 発現阻害剤、ペルオキシソーム増殖因子活性化受容体 (PPAR) に作用する薬剤、PPAR α 作動剤、リパーゼ清澄化因子刺激剤、コレステロール拮抗剤、血
- 10 小板凝固拮抗剤、抗酸化剤、コレステロール生合成阻害剤、LDL-受容体アップレギュレーター、胆汁酸封鎖剤、コレステロール吸収阻害剤及びニコチン酸が挙げられる。また、ACAT 阻害剤、アデノシン A1 作動剤、アポ B 発現阻害剤、アポ B 分泌阻害剤、ミクロソームトリグリセリド輸送タンパク質 (MTP) 阻害剤、HDL-コレステロール増加剤、コレステロールエ
- 15 ステル輸送タンパク質 (CETP) 阻害剤、回腸胆汁酸輸送体阻害剤、インスリン感受性増強剤、PPAR α 作動剤、PPAR γ 作動剤、PPAR δ 作動剤、スクアレニンダーゼ阻害剤、テストステロン作動剤、11 β -ヒドロキシステロイドデヒドロゲナーゼ阻害剤、15-リポキシゲナーゼ阻害剤、5-HT₂ 拮抗剤、ABCA1 発現増強剤、ACAT 阻害剤、レチノイド RXR 作動剤、肝臓 X 受
- 20 容体 (LXR) 作動剤、アセチル-CoA カルボキシラーゼ阻害剤、アセチル-CoA チオラーゼ阻害剤、アデノシン A_{2A} 作動剤、アデニル酸シクラーゼ活性化剤、アディポサイト FABP (aP2) 阻害剤、ケラチノサイト FABP (k-FABP) 阻害剤、アルドースレダクターゼ阻害剤、血管形成阻害剤、抗 ICAM-1 剤、抗酸化剤、VCAM-1 拮抗剤、抗エストロゲン剤、エストロゲン
- 25 作動剤、脂質過酸化阻害剤、アポ B 分泌阻害剤、アポ B-100 低減剤、アポトーシス誘導因子、アポトーシス阻害剤、ATP クエン酸リアーゼ阻害剤、 β 3-アドレナリン受容体作動剤、カルシウムチャネル阻害剤、カルニチンO-パルミトイルトランスフェラーゼ阻害剤、コレステロールエステラ
- 30 ソイド X 受容体 (FXR) 作動剤、甲状腺ホルモン受容体に作用する薬剤、甲状腺ホルモンに作用する薬剤、甲状腺ホルモン、副甲状腺ホルモン、ファルネシルトランスフェラーゼ阻害剤、グリコーゲンホスホリラーゼ a

阻害剤、ラノステロール 14 α -デメチラーゼ阻害剤、ラノステロールシンターゼ阻害剤、ヒスタミン H1 拮抗剤、酸化窒素シンターゼ阻害剤、トロンボキサン A2 拮抗剤、トリアシルグリセロールリパーゼ阻害剤、 α -グルコシダーゼ阻害剤、LDL-受容体アップレギュレーター、LYPLA1 発現阻

5 害剤、非ステロイド抗炎症剤、PDGFR 阻害剤、ホスホリパーゼ A2 阻害剤、血小板活性化因子 (PAF) 拮抗剤、カリウムチャネル活性化剤、プロスタグランジン、SCAP リガンド、スクアレンエポキシダーゼ阻害剤、選択的エストロゲン受容体調節剤 (SERM)、ステロール δ 14-レダクターゼ阻害剤、

10 バソプレッシン V1a 拮抗剤等も挙げられる。例えば、ロバスタチン、プラバスタチン (エプタスタチン) ナトリウム、フルバスタチン (フルインドスタイニン) ナトリウム、ロスバスタチンカルシウム、アトルバスタチンカルシウム、シンバスタチン (シンビノリン)、ピタバスタチン (イタバスタチン、ニスバスタチン) カルシウム、ロニフィブラート (ロニフィブラート)、ビニフィブラート (ビニフィブラート)、クリノフィブラート、

15 シプロフィブラート、クロフィブラート、エトフィブラート、フェノフィブラート、ベザフィブラート、ゲンフィブロジル、アシピモクス、エイコサペンタエン酸 (イコサペント、イコペネート、イコサペント酸) エチルエステル、プロブコール、ポリコサノール、塩酸コレセベラム、コレスチラミン (コレスチラミン樹脂)、塩酸コレスチポール、コレスチミド (コレスチラン)、エゼチミブ及びナイアシン (ニコチン酸)

20 が本発明化合物との併用医薬として組み合わせて使用される。また、併用医薬としては、パクチミブ、エフルチミブ、イムプリタミド、大型単層ベシクル、カムペスタノールアスコルビルホスフェート、シトスタノールアスコルビルホスフェート、ベシル酸アムロジピン、GW-493838、

25 RPR-749、BAY-13-9952、CP-346086、BTG-511、JTT-705、LY-518674 (LY-674)、ESP-31015 (ETC-1001)、ETC-642 (ESP-24228、RLT)、DRF-4832、S-8921、LY-510929 (LY-929)、GW-501516 (GW-516)、FM-VP4、JTT-130、GW-590735、641597、KRP-101、TAK-475、HE-2200 (3 β , 7 β , 17 β -アンドロステントリオール)、D-003、PLT-732、NS-220、KS-01-019、AZD-7806、

30 AZD-4619、AZD-6610、AZD-8294、ZYH-1、DRF-10945、SMP-797 等も使用される。

併用医薬として使用される肥満症治療薬としては、マジンドール、リ

- パーゼ阻害剤、5-HT/ノルエピネフリン再取り込みデュアルインヒビター、5-HT 再取り込み阻害剤、ハーバルエフェドリン及びカフェインを含むサプリメント、ヒト絨毛性性腺刺激ホルモン、アドレナリン受容体作動剤、メタアンフェタミン、フェンタミン及びアムフェプラモンが挙げられる。
- 5 また、カンナビノイド受容体に作用する薬剤、カンナビノイド CB1 受容体拮抗剤、カンナビノイド CB1 受容体逆作動剤、毛様体神経栄養因子 (CNTF)、成長ホルモン、成長ホルモン分泌促進剤、トリアシルグリセロールリパーゼ阻害剤、ABCA1 発現増強剤、アセチル-CoA カルボキシラーゼ阻害剤、アディポサイト FABP (aP2)阻害剤、アルドース レダクターゼ
- 10 阻害剤、 α -グルコシダーゼ阻害剤、 α -マンノシダーゼ阻害剤、ATP クエン酸リアーゼ阻害剤、アデノシン A1 受容体作動剤、セリンカルボキシペプチダーゼ阻害剤、 11β -ヒドロキシステロイドデヒドロゲナーゼ阻害剤、神経ペプチド Y (NPY)受容体に作用する薬剤、神経ペプチド Y2 (NPY Y2)受容体作動剤、神経ペプチド Y1 (NPY Y1)受容体拮抗剤、神経ペプチド Y5 (NPY Y5)受容体拮抗剤、CCK 拮抗剤、CCK1 (CCKA)作動剤、CCK2 (CCKB/ガストリン)拮抗剤、CRF1 拮抗剤、CRF2 作動剤、メラニン濃縮ホルモン (MCH)受容体に作用する薬剤、MCH 受容体拮抗剤、メラノコルチン受容体に作用する薬剤、メラノコルチン MC1 作動剤、メラノコルチン MC3 作動剤、メラノコルチン MC4 作動剤、メラノコルチン MC5 作動剤、オレキシン受容体拮抗剤、オレキシン OX-1 拮抗剤、オレキシン OX-2 拮抗剤、
- 20 ニューロテンシン作動剤、タキキニン NK2 拮抗剤、甲状腺ホルモンに作用する薬剤、甲状腺ホルモン受容体 β 作動剤、ガラニン GAL1 拮抗剤、GHS (グレリン)受容体逆作動剤、グルココルチコイド受容体調節剤、 β 2-アドレナリン受容体作動剤、 β 2-アドレナリン受容体拮抗剤、 β 3-アドレナリン受容体作動剤、 α 2-アドレナリン受容体拮抗剤、MAO 阻害剤、ドーパミン D1 拮抗剤、ドーパミン D5 拮抗剤、ドーパミン再取り込み阻害剤、ドーパミン放出薬、ノルエピネフリン再取り込み阻害剤、5-ヒドロキシトリプタミン受容体に作用する薬剤、5-HT 放出刺激剤、5-HT1A 拮抗剤、5-HT1B 作動剤、5-HT2 受容体に結合する薬剤、5-HT2A 拮抗剤、5-HT2B 作動剤、5-HT2C (5-HT1C)作動剤、5-HT6 受容体に結合する薬剤、5-HT6拮抗剤、ヒスタミン H3 受容体に結合する薬剤、ヒスタミン H3 拮抗剤、
- 30 オピオイド拮抗剤、 κ -オピオイド拮抗剤、エストロゲン作動剤、選択的

エストロゲン受容体調節剤 (SERM)、アポ B 分泌阻害剤、ミクソソームトリグリセリド輸送タンパク質 (MTP) 阻害剤、ベンゾジアゼピン、GABA (A) BZ 部位受容体作動剤、CEBPA 発現阻害剤オリゴヌクレオチド、SAPK1 (JNK) 阻害剤、DAT 阻害剤、NET 阻害剤、SERT 阻害剤、ジペプチジルペプチダーゼ IV 阻害剤、グルカゴン様ペプチド 1 (GLP-1) 受容体に作用する薬剤、トリペプチジルペプチダーゼ II 阻害剤、ペルオキシソーム増殖因子活性化受容体 (PPAR) に作用する薬剤、PPAR α 作動剤、PPAR γ 作動剤、PPAR γ 拮抗剤、PPAR γ 部分的作動剤、PPAR δ 作動剤、レチノイド RXR 作動剤、レチノイド RXR 拮抗剤、脂肪酸シントラーゼ阻害剤、グリコーゲンホスホリラーゼ阻害剤、HMG-CoA レダクターゼ阻害剤、タンパク質チロシンホスファターゼ (PTP)-1B 阻害剤 (本発明化合物以外)、メタロポルフィリン、酸化窒素シントラーゼ阻害剤、非ステロイド抗炎症薬、ホスホジエステラーゼ III 阻害剤、ホスホジエステラーゼ PDE3B 阻害剤、SGLT-1 阻害剤、SGLT-2 阻害剤、 σ 受容体リガンド等も挙げられる。例えば、マジンドール、オルリスタット、塩酸シブトラミン水和物、塩酸フルオキセチン、絨毛性性腺刺激ホルモン (ヒト)、NCP システムを用いる VNS 療法、メタラミノール、塩酸 d-メタアンフェタミン、フェンテルミン、塩酸アムフェプラモン (ジェチルプロピオン)、塩酸ベンズフェタミン及び酒石酸フェンジメトラジンが本発明化合物との併用医薬として組み合わせて使用される。また、併用医薬としては、塩酸リモナバント、SR-147778、CNTF (Ax15) (RG-228、RPN-228)、ポリエチレングリコール化アクソカイン、GI-181771、SR-146131、SR-125180、AOD-9604、ATL-962、PYY3-36 (AC-162352)、N-5984、L-796568、ガルシニア酸 ((-)-ヒドロキシクエン酸)、HMR-1426、P-57、1954、ピコリン酸クロム/異性化リノール酸、S-2367、APD-356、BVT-5182、Ucn II、C-75、gAcrp30、KB-141、NLC-002、BLX-2002、P-64、T-71 等も使用される。

併用医薬として使用される高血圧症治療薬としては、チアジド、アルドステロン拮抗剤、アドレナリン作動性ニューロン遮断薬、カルシウムチャネル遮断薬、ドーパミン D2 拮抗剤、 β -アドレナリン受容体拮抗剤、 α 2-アドレナリン受容体作動剤、グアニル酸シクラーゼ活性化剤、 β 1-アドレナリン受容体拮抗剤、 α 1-アドレナリン受容体拮抗剤、抗酸化剤、アンギオテンシン-I 変換酵素 (ACE) 阻害剤、Na⁺/H⁺ 交換阻害剤、 α -アド

- レナリン受容体拮抗剤、酸化窒素供与体、5-HT₂ 拮抗剤、K(ATP)チャネル活性化剤、カリウム保持性利尿性プロスタグランジンシンターゼ刺激剤、イミダゾリン I₁ 受容体作動剤、アンギオテンシン AT₁ 拮抗剤、ドーパミン D₁ 作動剤、グアニル酸シクラーゼ刺激剤、エンドセリン ETA 受容体拮抗剤、エンドセリン ETB 受容体拮抗剤、NOS3 発現増強剤、プロスタサイクリンアナログ、プロスタグランジン、アンギオテンシン II 拮抗剤、電解質吸収作動剤、ニコチン拮抗剤、ドーパミン D₂ 作動剤、プロラクチン阻害剤、血小板活性化因子 (PAF) 拮抗剤、血小板凝固拮抗剤、腫瘍壊死因子拮抗剤、Rho キナーゼ阻害剤、PPAR α 作動剤、AMPA 受容体調節剤；
- 10 GABA(A)受容体拮抗剤及びホスホジエステラーゼ V (PDE5A)阻害剤が挙げられる。また、5-HT_{1A} 受容体作動剤、5-HT_{1B} 拮抗剤、5-HT_{2A} 拮抗剤、ACAT 阻害剤、アデノシン A₁ 作動剤、アデノシン A₁ 拮抗剤、アデノシン A_{2A} 作動剤、アデノシン A_{2A} 拮抗剤、アデニル酸シクラーゼ活性化剤、アドレナリン作動性ニューロン遮断薬、AGE 阻害剤(メイラード反応阻害剤)、
- 15 アルドースレダクターゼ阻害剤、アルカロイド、 α -アドレナリン受容体リガンド、 α 1A-アドレナリン受容体拮抗剤、 α 2-アドレナリン受容体拮抗剤、 β 2-アドレナリン受容体拮抗剤、 β 2-アドレナリン受容体作動剤、 α -心房性ナトリウム利尿ペプチド、血管形成阻害剤、アポトーシス阻害剤、アンギオテンシン AT₂ 拮抗剤、アンギオテンシン受容体拮抗剤、抗
- 20 炎症剤、フリーラジカル捕捉剤、カルシウムチャネル活性化剤、L 型カルシウムチャネル阻害剤、cAMP ホスホジエステラーゼ阻害剤、カンナビノイド CB₂ 作動剤、カンナビノイド受容体作動剤、パニロイド VR₁ 受容体作動剤、キマーゼ阻害剤、シクロオキシゲナーゼ-2 阻害剤、ドーパミン自己受容体作動剤、ドーパミン受容体作動剤、ドーパミン D₁ 作動剤、ド
- 25 ーパミン D₁ 拮抗剤、ドーパミン- β -モノオキシゲナーゼ阻害剤、エンドセリン受容体拮抗剤、エンドセリン受容体作動剤、エンドセリン変換酵素阻害剤、エンケファリナーゼ阻害剤、グリコーゲンホスホリラーゼ α 阻害剤、成長ホルモン放出阻害剤、ソマトスタチンアナログ、ヒスタミン H₁ 作動剤、ヒスタミン H₁ 拮抗剤、低酸素誘導性因子 1- α (HIF-1 α) 阻
- 30 害剤、イミダゾリン受容体に作用する薬剤、インスリンアナログ (亜鉛錯体)、インスリン感受性増強剤、PPAR γ 作動剤、インスリン低減剤、K(ATP) チャネル阻害剤、リポキシゲナーゼ阻害剤、高伝導性 BK(Ca)チャ

- ネル活性化剤、 Na^+/K^+ -ATP アーゼ阻害剤、NADPH オキシダーゼ阻害剤、ネプリライシン阻害剤、神経ペプチド Y1 (NPY Y1) 拮抗剤、神経ペプチド Y4 (NPY Y4) 作動剤、硝酸、非ステロイド抗炎症剤、プロテインキナーゼ C (PKC) 阻害剤、オリゴヌクレオチド、PDGFR 阻害剤、ホスホジエステラーゼ阻害剤、ホスホジエステラーゼ I 阻害剤、ホスホジエステラーゼ III 阻害剤、ホスホジエステラーゼ IV 阻害剤、カリウムチャネル活性化剤、プロスタノイド IP 作動剤、プロスタノイド TP (トロンボキサン A2) 拮抗剤、トロンボキサンシンターゼ阻害剤、プロテアーゼ阻害剤、プロテアソーム阻害剤、プロテインキナーゼ C (PKC) 阻害剤、レニン阻害剤、 σ 受容体拮抗剤、ナトリウムチャネル遮断剤、チアジド、トリグリセリド低減剤、バソプレッシン拮抗剤、バソプレッシン V1a 拮抗剤、バソプレッシン V2 拮抗剤等も挙げられる。例えば、クロロチアジド、ヒドロクロロチアジド、ヒドロフルメチアジド、メチクロロチアジド、ポリチアジド、サイパミド、シクロペンチアジド、ベンドロフルメチアジド (ベンドロフルアジド)、スピロノラクトン、エポキシメクスレノン (エプレレノン)、モノ硫酸グアナチジン、硫酸グアナドレル、ベラパミル、塩酸プロプラノロール、塩酸アルブレノロール、ピンドロール、塩酸オクスプレノロール、マレイン酸チモロール、塩酸ソタロール、塩酸アセプトロール、塩酸カルテオロール、硫酸メピンドロール、塩酸アロチノロール、塩酸インデノロール、塩酸タータトロール、塩酸セリプロロール、塩酸チリソロール、ネビボロール、硫酸ペンブトロール、ナドロール、塩酸クロラノロール、塩酸ベバントール (ベバントロール)、クロニジン、塩酸グアンファシン、塩酸ジルチアゼム、塩酸ニカルジピン、ニトレンジピン、フェロジピン、ニルバジピン、ニバジピン、ニソルジピン、塩酸ベニジピン、ベシル酸アムロジピン、塩酸フラニジピン (マニジピン)、ラシジピン、イスラジピン、塩酸バルニジピン (メピロジピン)、塩酸エホニジピン エタノール、シナルジピン (シルニジピン)、アラニジピン、塩酸レルカニジピン (マスニジピン)、アゼルニジピン、アムロジピン、マニジピン (フラニジピン)、ニトロプルシドナトリウム、アテノロール、酒石酸メトプロロール、塩酸ベタキソロール、ボピンドロール、フマル酸ピソプロロール、塩酸エスモロール、カルベジロール、コハク酸メトプロロール、タリノロール、塩酸プラゾシン、ウラピジル、塩酸インド

- ラミン、塩酸ブナゾシン、塩酸テラゾシン、メシル酸ドキサゾシン、ウ
ラピジル、ニフェジピン、カプトプリル、マレイン酸エナラプリル、リ
シノプリル、ペリンドプリル、アラセプリル、ラミプリル、塩酸キナプ
5 リラート、フォシノプリルナトリウム、トランドラプリル、スピラプリ
ル、塩酸テモカプリル、塩酸モエキシプリル、塩酸イミダプリル、ゾフ
エノプリルカルシウム、エナラプリラート、ゾフェノプリラート、塩酸
アミロライド、塩酸ラベタロール、ニブラジロール（ニブラドロール）、
リンシドミン、ケタンセリン、ピナシジル、シクレタニン（シクレタニ
10 ド）、塩酸アモスラロール、塩酸モキシソニジン水和物、ロサルタンカリウ
ム、バルサルタン、メシル酸エプロサルタン、カンデサルタンシレキセ
チル（ヘキセチル）、イルベサルタン、テルミサルタン、オルメサルタン
メドキシミル、メシル酸フェノルドパム、カドララジン、リン酸二水素
リルメニジン、ボセンタン、ベラプロストナトリウム、リマプロスト
15 アルファデックス（ α -シクロデキストリン）、ユニプロスト（トレプロ
スチニルナトリウム）、イロプロスト（シロプロスト）、塩酸メカミルア
ミン、メテルゴリン、酢酸グアナベンズ、クロリクロメン、ファスジル、
ドコネクセント（ドコサヘキサエン酸）、シクロチアジド、クエン酸シル
デナフィル、クロルタリドン、キネタゾン、インダパミド、メトラゾン、
20 塩酸フェノキシベンザミン、メチロシン、ジアゾキシド、トラセミド
（トルセミド）、クロパミド、塩酸ヒドララジン、レセルピン及びメチル
ドパが本発明化合物との併用医薬として組み合わせて使用される。また、
併用医薬としては、オマパトリラート、アラドトリル（アラトリオプリ
ル、ファシドトリル）、AVE-7688（MDL-107688）、796406、レミルジピン、
25 プラニジピン、クレビジピン、レブアムロジピン（(S)-アムロジピン）、
アムブリセンタン、シタクスセンタンナトリウム、SPP-301（R-639、R0-
67-0565）、TBC-3711、PMD-2850（アンギオテンシンワクチン）、PMD-3117、
ビノデノゾン、塩酸アラゲプリウム、SLV-306、フマル酸アリスキレン、
NV-04、MC-4232、ENO、MDL-72832、BP-554、(+)-OSU-191（OSU-191-(+)、
30 U-86192A）、WAY-100339、QF-303B（QF-0303B）、QF-307B（QF-0307B）、
QF-311B（QF-0311B）、リンダンセリン（ZK-33839）、AP-1067、AHR-
16303B、QF-313B（QF-0313B）、S-14280、S-35031、S-35120、PR-1173、

- RG-14718、CCPA、S-ENBA、Sch-59761、FR-166124、GU-285、MDL-101483、
CVT-2995、CVT-3032、CVT-3033、2HE-NECA (HENECA)、CGS-21680、CGS-
22492、CGS-22989、SHA-40、APEC、KF-17837、OPB-9195、リソスペルミ
ン酸 B マグネシウム塩 (リソスペルミン酸 B マグネシウム)、6-ヨードア
5 ミロライド、6-プロトベルベリン (PTB-6)、CR-2991、HSR-175、CDRI-
93/478、DC-015 (DC-028、DL-028A)、BAM-2202、GB-67、YM-11133、
Abbott-65265、SK&F-104856、MG-1、L-765314、KMUP-880602、A-68828、
YC-1、AB-47、C-112、ウチバプリラート、FPL-63674 (FPL-63674XX、
FPL-63547-二酸)、FPL-66564、MDL-100173、MDL-27467A、グリコプリル、
10 R00 911、SQ-31440、DU-1777、S-ニトロソカプトプリル (SNOCAP)、Y-
23785、硝酸エナラプリル、モエキシプリラート (RS-10029)、テモカプ
リラート (RS-5139)、CV-5975、イミダプリラート (6366 A)、REV-6134、
BW-B385C、CGS-26582、SA-6817、SA-7060、Sch-54470、S-アリルメルカ
プトカプトプリル (CPSSA)、RB-106、MDL-101628、ミキサンプリル、フ
15 アシドトリラット (アラトリオプリラート)、BMS-182657、ER-32897、
ER-32935、ER-40121、ER-40133 (E-4030)、CGS-28106、CGS-30440、Sch-
50690、A-81282 (Abbott-81282)、A-81988、GA-0050、GA-0113、ZD-7155、
RU-63455、RU-64276、RU-65868、エムブサルタン (Bay-10-6734)、BIBS-
39、BMS-180560、BMS-181688、BMS-184698、EXP-063、EXP6155、EXP-
20 7711 (IMI)、EXP-9270、S-8308、XD-937、XH-148、UP-221-78、UP-275-
22、FI-6828K、FR-130739、FR-143187、FR-149581、LR-B/087、RWJ-
38970、RWJ-46458、WK-1492 (WK-1492.2K)、KR-31080 (SK-1080)、KT3-
579、KT3-866、KW-3433、LY-285434、LY-301875、LY-302289、L-158338、
L-158659、L-158978、L-159093、L-159689、L-161177、L-162154、L-
25 162223、L-162234、L-162393、L-162474、L-163313、L-163579、EMD-
69943、EMD-90423、チサルタン (CGP-48369)、アビテサルタン (CGP-
49870)、CP-161418、CP-191166、PD-123177 (EXP-655)、PD-123319、PD-
150304、SC-50560、SC-51316、SC-51757、SC-51895、SC-54628、SC-
54629、U-97018、RWJ-47639、TH-142177、CV-11194、606A、TA-606、
30 LCY-018、CR-3210、UP-275-13、UR-7198、UR-7280、WK-1260、CL-190133
(CL-332877、CL-190733、CL-190734)、WAY-126227、YM-31472、EXP-408、
XR-510、L-161021、L-162389、L-162441、L-162537、L-163007、L-

- 163017、L-163958、BMS-248360、DMP-811 (DuP-811、L-708404)、SB-203220、LR-B/057、L-159913、L-161816、セサミン、フェルリノロール、PF-9104、TZC-1370、O-パルミトイルチリソロール、BG6、TZC-8159、Y-22516、塩酸オルラジピン(S-11568)、PCA-50938、H-324/38、ZM-224832、
- 5 HP-406、BMV-43011、SQ-32321、SQ-32547、SQ-33351、エルナジピン、リンコフィリン、SUN-5647、VULM-999、DCDDP、サガンジピン、GR-60139、Goe-5584-A、臭化水素酸シラチアゼム LR-A/113)、GS-386、ソルニジピン、MCF-1084、MCF-1113、ジブジピン、重水素化ニフェジピン (ISA-1058)、McN-6497 (RWJ-26902)、CRL-41695、(4S)-(+) -AE0047、Y-24149、s-ペタ
- 10 シン、NIP-101、UK-52831、UK-55444、UK-56593、UK-51656、P-1268、BBR-2160、RS-88007、RS-5773、SL-85.1097、83-0256、83-0327、S-312 (83-0312)、MR-14134、AHR-12742、AHR-16462B、AHR-5360C (AHR-5360)、BMV-20014、BMV-20064、BMV-42803、ペロキササン、ラベジピンジロール B、ラベジピンジロール A、FR-172516、バニジピンジロール、キサントノロ
- 15 ール、Z-6568、F-1850、Wy-27569、M-54033、HU-308、アルバニル、BL-3875、BL-4027、TEI-E00548、ルタエカルピン (ルテカルピン)、PD-139899、FPL-65447AA、Z-12571、Z-7760、(S)-Z-11410、FR-138104、MDL-43925、SK&F-102698、A-292438、A-306552、RPR-117820A、RPR-118031A、J-105510、J-105859、J-112287、BMS-182874、TBC-11040、
- 20 TEC-11192、TBC-2576、TEC-3214、SB-247083、EMD-122946、EMD-94246、ファンドセンデンカリウム (CI-1034、PD-180988)、PABSA、YM-62399、YM-91746、LU-302872 (BSF-420627、LU-420627)、BMS-187308、IRL-3630、L-747844、RPR-111844、PD-163070、PD-166309、PD-142893、A-192621、CGS-31398、IRL-1620、BQ-485、FR-901366 (WS-009A)、KET-011、RES-
- 25 701-1 (KF-20704)、L-744453、L-749329、L-749805、IRL-1737、PD-155080、PD-156252、T-0115 (TA-0115)、S-17162、WS-79089B (WS-79089-3、FR-901533)、SM-19712、CGS-26303、CGS-26393、CGS-30084、CGS-34043、CGS-34225、CGS-34226、CGS-34753、CGS-35066、KC-12792、SQ-28603、CP-91149、BAY-41-2272、BAY-41-8543、BAY-58-2667、KMUP-1、
- 30 メチルヒスタプロジフェン、スプラヒスタプロジフェン、S-23515、S-23757、LNP-509、LNP-911、Zn(car)2C12、DRF-4158 (DRF-MDX8、LBL-752)、DY-9804、MJ-355、BPDZ-79、BPDZ-83、YM-099、サラカリム (RS-

91309)、PNU-96293、NS-1608、CPU-23、PST-2107、アポシニン、CGS-24128、CGS-24592、CGS-25155、H-394/84、BIBO-3304、1229U91 (GR-231118、BW-1229U91、GW-1229)、RS-7897、C92-4609 (CAS-1609)、CHF-2363 (SN011)、PROLI/NO、FR-144420、GEA-3175、DS1、NOC-7、MAHMA
5 MONOate、PF-9404、EDTA (エデト酸)、AS-AT1R-ODN mRNA、NX-1975、5E3623、Sch-51866、Sch-59498、LAS-31180、SK&F-94120、SK&F-95654、Win-63291、DMPP0、DF-100 (A80a)、E-4010、ザプリナスト (M&B-22948)、T-1032、塩酸イブタカリム、ZM-260384、RP-66784、S-0121、BMS-182264、KC-399、KC-515、SG-209、DY-9708、ER-001533、RWJ-26629、U-94968、
10 KI-4032、KRN-4884、KR-30818 (SKP-818)、P-1060、LM-3339、MCC-134、AL-0671、AL-0670、Y-26763、PC-286、TAK-636、ジオクレイン、UR-8081、UR-8218、UR-8225、UR-8267、CL-188294、LP-805、KMUP-880708、クロマカリム、BW-68C、FR-181157、FR-181877、ER-017996、PSI、MDL-29152、A-62198、A-65317、A-68064、A-82110、A-70461、ICI-219623、MDL-
15 73323、MDL-74147、S-2864、BW-175、BILA-2157、SQ-30774、SQ-31844、SQ-33800、JTP-2438、JTP-2724、JTP-3072、JTP-4129、JTV-505 (JTP-4761)、KRI-1177、KRI-1314、CGP-44099A、CGP-54061、CGP-55128A、CGP-56346A、CGP-56962A、CGP-62198A、CP-108671、CP-71362、PD-132002、SC-46944、SC-56525、U-77436、Ro-44-9375、Ro-66-1132 (Ro-
20 0661132、Ro-X1)、Ro-X2、SPF-600、CL-331049、WAY-121604、YM-21095、YM-26365、ヒドロキシファスジル、Y-30141、H-1152 (HMN-1152)、CNS-1307、Ono-1505、JTV-605、YM-176770、JNJ-17079166、FR-161282 等も使用される。

併用医薬として使用される血栓症治療薬には、ヘパリン製剤、低分子
25 量ヘパリン、ヘパリンアナログ、抗凝固剤、トロンビン阻害剤、抗トロンビン製剤、抗血小板剤、血栓溶解剤等が挙げられる。例えば、ヘパリンカルシウム、ヘパリンナトリウム、ダルテパリンナトリウム、パルナパリンナトリウム、レビパリンナトリウム、ダナパロイドナトリウム、ワルファリンカリウム、アルガトロバン、メシル酸ガベキセート、メシ
30 ル酸ナファモスタット、ヒトアンチトロンビン III、アスピリン、ジピリダモール、塩酸チクロピジン、シロスタゾール、リマプロストアルファデックス、ナトリウムオザグレル、塩酸サルボグレラート、イコサペン

ト酸エチル、ベラプロストナトリウム、ウロキナーゼ、チソキナーゼ、アルテプラゼ、ナサルプラゼ、ナテプラゼ、モンテプラゼ、パミテプラゼ、パトロキソピン、クエン酸ナトリウム、プロテインC等が本発明化合物との併用医薬として組み合わせて使用される。

- 5 次に、本発明を実施するために用いる化合物の製造方法の例を説明する。しかしながら、本発明化合物の製造方法はこれらに限定されるものではない。

本製法に記載はなくとも、必要に応じて官能基に保護基を導入し後工程で脱保護を行う、各製法及び工程の順序を入れ替えるなどの工夫によ

- 10 り効率よく製造を行えばよい。

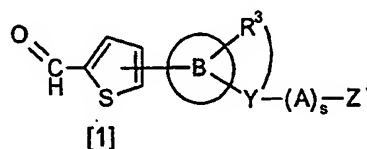
また、各工程において、反応後の処理は、抽出、洗浄、濃縮、濾過、pH調整等の通常行われる方法で行えばよく、単離精製は、結晶化、再結晶化、シリカゲルクロマトグラフィー、分取HPLC等の慣用される方法を適宜選択してもよく、また選択する場合には組み合わせて行って

- 15 もよい。

製法 1

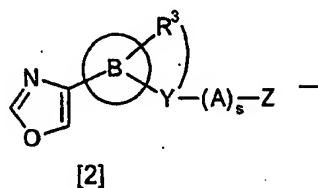
本製法は、mが1であり、 R^1 及び R^2 がそれぞれ水素原子であり、Xが $-N(R^4)-$ 、 $-N(R^5)-CO-O-$ 、 $-O-$ 又は $-S-$ である化合物[I]を製造する方法である。

Vが=CH-、Wが-S-の場合

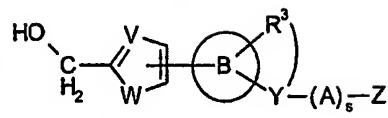


工程1

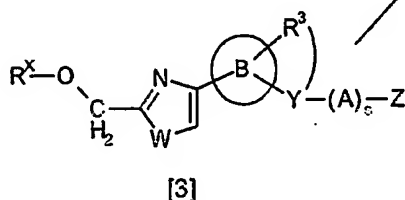
Vが=N-、Wが-O-の場合



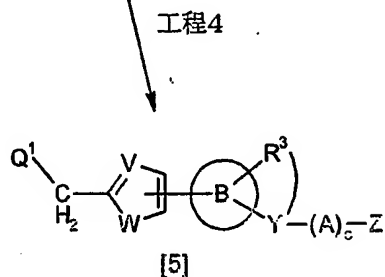
工程2



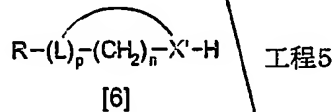
Vが=N-、Wが-S-又は-O-の場合



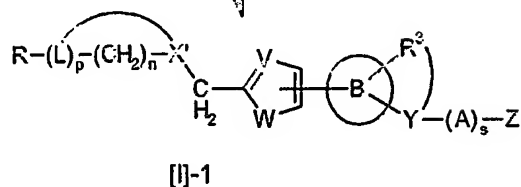
工程3



工程4



工程5



- (式中、Q¹は一般的な脱離基(例えば、ハロゲン原子(臭素原子、ヨウ素原子、塩素原子等)、メシルオキシ基、トシルオキシ基、トリフルオロメタンスルホニルオキシ基等)を示し、R^xは一般的な水酸基の保護基(例えば、tert-ブチルジメチルシリル基、ベンゾイル基等)を示し、X'は-N(R⁴)-、-N(R⁵)-CO-O-、-O-又は-S-(式中、各記号は前記定義の通りである)を示し、その他の各記号は前記定義の通りである。)

化合物[1]を溶媒中、通常の還元剤を用いる還元法により化合物[4]を得ることができる。溶媒としては、アルコール類（メタノール、エタノール等）、エーテル系溶媒（テトラヒドロフラン、ジオキサン等）、トルエン等、又はそれらの混合溶媒が挙げられる。還元剤としては、水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウム、ジボラン、水素化アルミニウムリチウム等が挙げられる。反応は冷却下乃至加熱下にて行うことができる。

工程 2

化合物[2]を溶媒中、塩基の存在下、パラホルムアルデヒドと反応させてヒドロキシメチル化することにより、化合物[4]を得ることができる。溶媒としては、トルエン、エーテル系溶媒（テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル等）等、又はそれらの混合溶媒が挙げられる。塩基としては、アルキルリチウム（*n*-ブチルリチウム、*sec*-ブチルリチウム、*tert*-ブチルリチウム等）及び2, 2, 6, 6-テトラメチルピペリジンを用いて形成される塩基、又はリチウムジイソプロピルアミン等が挙げられる。反応は冷却下にて行うことができる。

工程 3

化合物[3]のR^xを、常法に従って脱保護することにより、化合物[4]を得ることができる。例えば、R^xがベンゾイル基の場合、製法19における工程30で例示する方法と同様の反応を行うことにより目的物を得ることができる。

工程 4

化合物[4]の水酸基を、製法10における工程1.8と同様に一般的な脱離基に置換することにより、化合物[5]を得ることができる。

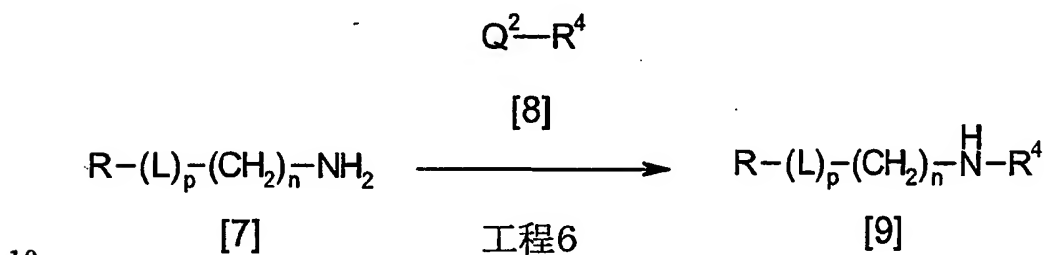
25 工程 5

化合物[5]を溶媒中、塩基の存在下、触媒の存在下又は非存在下で化合物[6]と反応させることにより、化合物[I]-1を得ることができる。溶媒としては、N, N-ジメチルアセトアミド、N, N-ジメチルホルムアミド、アセトニトリル、酢酸エチル、トルエン、アルコール系溶媒（メタノール、エタノール等）、エーテル系溶媒（テトラヒドロフラン、ジオキサン等）、ハロゲン系溶媒（クロロホルム、ジクロロメタン等）等、又はそれらの混合溶媒が挙げられる。塩基としては、炭酸カリウム、炭酸

- ナトリウム等の無機塩基類、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン等の有機塩基類が挙げられる。触媒としては、ヨウ化カリウム、4級アンモニウム塩（ヨウ化テトラブチルアンモニウム、臭化テトラブチルアンモニウム等）等が挙げられる。反応は冷却下乃至加熱下にて行うことができる。

製法 2

本製法は、製法 1 における工程 5 で使用する化合物 [6] のうち、X' が $-N(R^4)-$ である化合物を製造する方法である。



（式中、 Q^2 は製法 1 記載のごとく一般的な脱離基を示し、その他の各記号は前記定義の通りである。）

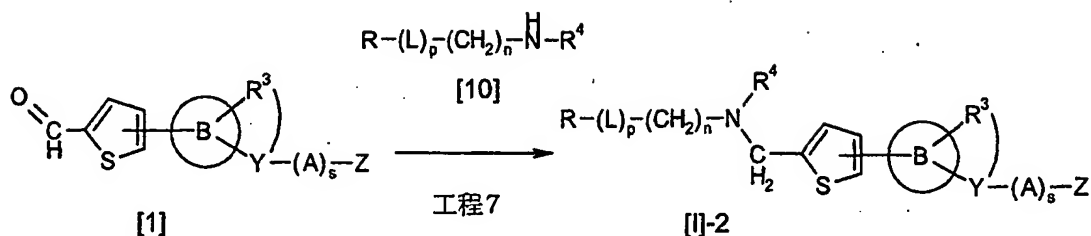
工程 6

- 化合物 [7] を溶媒中、塩基の存在下、触媒の存在下又は非存在下で化合物 [8] と反応させることにより、化合物 [9] を得ることができる。溶媒としては、N, N-ジメチルアセトアミド、N, N-ジメチルホルムアミド、アセトニトリル、酢酸エチル、トルエン、アルコール系溶媒（メタノール、エタノール等）、エーテル系溶媒（テトラヒドロフラン、ジオキサン等）、ハロゲン系溶媒（クロロホルム、ジクロロメタン等）等、又はそれらの混合溶媒が挙げられる。塩基としては、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム等の無機塩基類、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン等の有機塩基類が挙げられる。触媒としては、ヨウ化カリウム、4級アンモニウム塩（ヨウ化テトラブチルアンモニウム、臭化テトラブチルアンモニウム等）等が挙げられる。反応は冷却下乃至加熱下にて行うことができる。

製法 3

本製法は、V が $=CH-$ であり、W が $-S-$ であり、m が 1 であり、

R^1 及び R^2 がそれぞれ水素原子であり、 X が $-N(R^4)-$ である化合物 [I] を製造する方法である。



5

(式中、各記号は前記定義の通りである。)

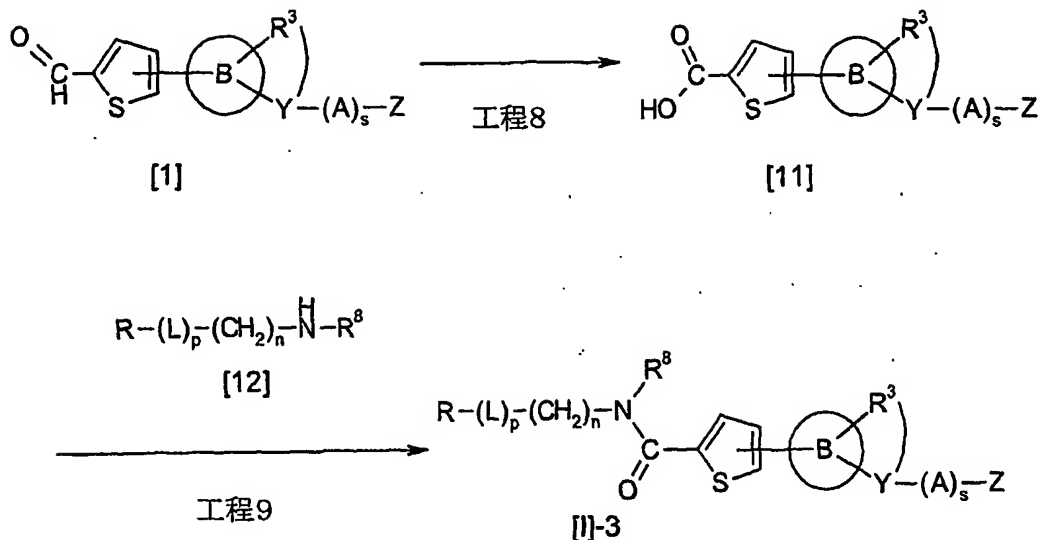
工程 7

化合物 [1] を溶媒中、還元剤の存在下、塩基の存在下又は非存在下で化合物 [10] と反応させることにより、化合物 [I]-2 を得ることができる。溶媒としては、N, N-ジメチルアセトアミド、N, N-ジメチルホルムアミド、アセトニトリル、酢酸エチル、トルエン、エーテル系溶媒（テトラヒドロフラン、ジオキサン等）、ハロゲン系溶媒（クロロホルム、ジクロロメタン、1, 2-ジクロロエタン等）、アルコール系溶媒（メタノール、エタノール等）、酢酸等、又はそれらの混合溶媒が挙げられる。還元剤としては、水素化ホウ素ナトリウム、トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウム、水素化シアノホウ素ナトリウム等が挙げられる。塩基としては、ピリジン等の有機塩基類が挙げられる。反応温度は $0^{\circ}\text{C} \sim 80^{\circ}\text{C}$ が好適である。

15

製法 4

20 本製法は、 V が $=\text{CH}-$ であり、 W が $-\text{S}-$ であり、 m が 0 であり、 X が $-N(R^8)-\text{CO}-$ である化合物 [I] を製造する方法である。



(式中、各記号は前記定義の通りである。)

工程 8

化合物[1]を溶媒中、通常の酸化剤を用いるアルデヒドの酸化法により化合物[11]を得ることができる。溶媒としては、アルコール類（メタノール、エタノール等）、エーテル系溶媒（テトラヒドロフラン、ジオキサン等）、アセトン、酢酸、水等、又はそれらの混合溶媒が挙げられる。酸化剤としては、亜塩素酸ナトリウム（必要に応じて塩素のスキャベンジャー（スルファミン酸等）を加える）、次亜塩素酸ナトリウム、過マンガン酸カリウム、クロム酸ナトリウム、硝酸銀、酸化銀、2, 2, 6, 6-テトラメチルピペリジーン-N-オキシド等が挙げられる。反応は冷却下乃至加熱下にて行うことができる。

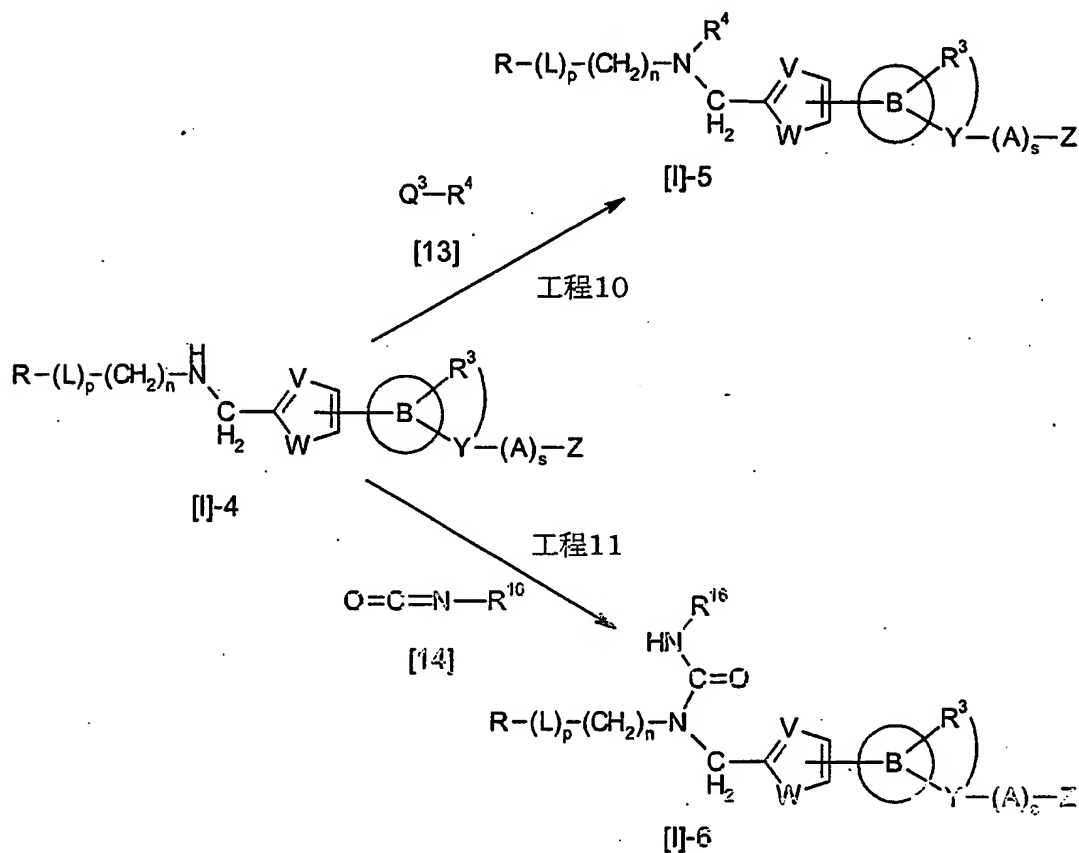
工程 9

化合物[11]を化合物[12]（製法2において化合物[9]を得るのと同様の方法にて得ることができる）とアミド縮合させることにより化合物[I]-3を得ることができる。アミド縮合は常法に従って行うことができる。例えば、N, N-ジメチルホルムアミド、アセトニトリル、テトラヒドロフラン、クロロホルム、酢酸エチル、塩化メチレン、トルエン等の溶媒中、ジシクロヘキシルカルボジイミド、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド・塩酸塩、ジフェニルホスホリルアジド等の縮合剤の存在下で、また、N-ヒドロキシスクシンイミド、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール等の存在下又は非存在下で縮合させる

方法が挙げられる。反応温度は0℃～100℃が好適である。

製法5

本製法は、 m が1であり、 R^1 及び R^2 がそれぞれ水素原子であり、 X が $-N(R^4)-$ である化合物[I]を製造する方法である。



5

(式中、 Q^3 は製法1記載のごとく一般的な脱離基を示し、その他の各記号は前記定義の通りである。)

工程10

- 10 化合物[I]-4 (製法1において化合物[I]-1を得るのと同様の方法にて得ることができる)を溶媒中、塩基の存在下又は非存在下で化合物[13]と反応させることにより、化合物[I]-5を得ることができる。溶媒としては、N,N-ジメチルアセトアミド、N,N-ジメチルホルムアミド、アセトニトリル、酢酸エチル、トルエン、エーテル系溶媒 (テトラヒドロフラン、ジオキサン等)、ハロゲン系溶媒 (クロロホルム、ジクロロメタン等) 等、又はそれらの混合溶媒が挙げられる。塩基としては、炭酸
- 15

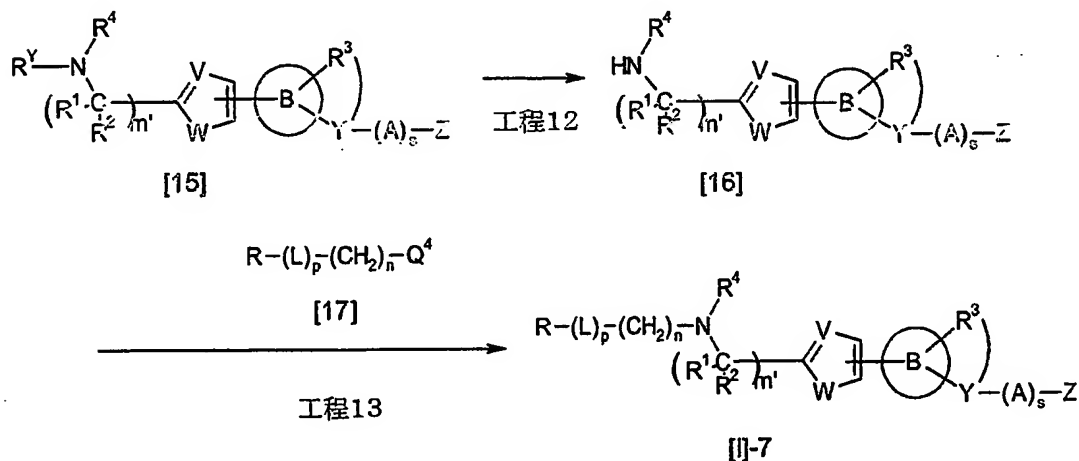
カリウム、炭酸ナトリウム等の無機塩基類、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン等の有機塩基類が挙げられる。反応は冷却下乃至加熱下にて行うことができる。

工程 1 1

- 5 化合物[I]-4 を溶媒中、塩基の存在下又は非存在下で化合物[14]と反応させることにより、化合物[I]-6 を得ることができる。溶媒としては、N, N-ジメチルアセトアミド、N, N-ジメチルホルムアミド、アセトニトリル、酢酸エチル、トルエン、エーテル系溶媒（テトラヒドロフラン、ジオキサン等）、ハロゲン系溶媒（クロロホルム、ジクロロメタン等）等、
- 10 又はそれらの混合溶媒が挙げられる。塩基としては、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム等の無機塩基類、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン等の有機塩基類が挙げられる。反応は冷却下乃至加熱下にて行うことができる。

製法 6

- 15 本製法は、m が 1 又は 2 であり、X が $-N(R^4)-$ である化合物[I]を製造する方法である。



- 20 (式中、m' は 1 又は 2 を示し、Q⁴ は製法 1 記載のごとく一般的な脱離基を示し、R^Y は tert-ブトキシカルボニル基、ベンジルオキシカルボニル基等のアミンの保護基を示し、その他の各記号は前記定義の通りである。)

工程 1 2

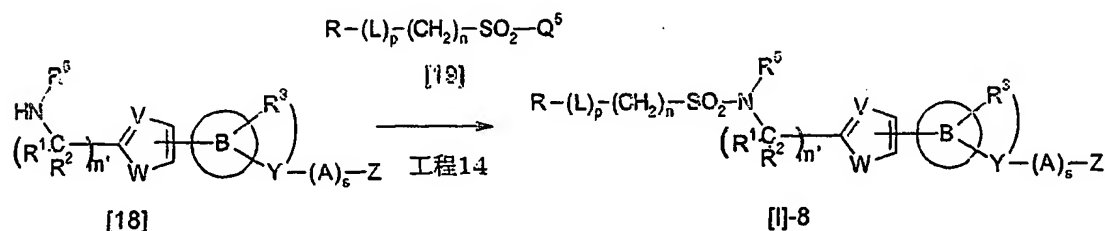
化合物[15]の R^Y を脱保護することにより化合物[16]を得ることができる。脱保護は常法に従って行うことができる。例えば、 R^Y がtert-ブトキシカルボニル基の場合には、ジオキサン等の溶媒中、塩化水素と反応させる方法が挙げられる。反応温度は0℃～室温が好適である。

5 工程13

化合物[16]を溶媒中、塩基の存在下で化合物[17]と反応させることにより、化合物[I]-7を得ることができる。溶媒としては、N,N-ジメチルアセトアミド、N,N-ジメチルホルムアミド、アセトニトリル、酢酸エチル、トルエン、エーテル系溶媒（テトラヒドロフラン、ジオキサン等）、ハロゲン系溶媒（クロロホルム、ジクロロメタン等）等、又はそれらの混合溶媒が挙げられる。塩基としては、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム等の無機塩基類、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン等の有機塩基類が挙げられる。反応は冷却下乃至加熱下にて行うことができる。

15 製法7

本製法は、 m が1又は2であり、 X が $-SO_2-N(R^5)-$ である化合物[I]を製造する方法である。



20

（式中、 Q^5 はハロゲン原子（臭素原子、ヨウ素原子、フッ素原子、塩素原子等）を示し、その他の各記号は前記定義の通りである。）

工程14

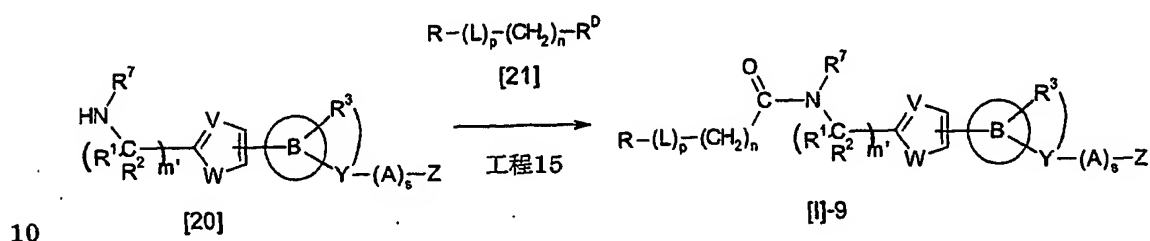
化合物[18]（製法6において化合物[16]を得るのと同様の方法にて得ることができる）を溶媒中、塩基存在下、化合物[19]と反応させることにより、化合物[I]-8を得ることができる。溶媒としては、N,N-ジメチルアセトアミド、N,N-ジメチルホルムアミド、アセトニトリル、酢酸エチル、トルエン、エーテル系溶媒（テトラヒドロフラン、ジオキ

サン等)、ハロゲン系溶媒(クロロホルム、ジクロロメタン等)等、又はそれらの混合溶媒が挙げられる。塩基としては、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム等の無機塩基類、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン等の有機塩基類が挙げられる。反応は室温乃至加熱下にて行うこと

5 ができる。

製法 8

本製法は、 m が 1 又は 2 であり、 X が $-CO-N(R^7)-$ である化合物 [I] を製造する方法である。



(式中、 R^D はカルボキシ基又はハロゲン原子(臭素原子、ヨウ素原子、フッ素原子、塩素原子等)で置換されたホルミル基を示し、その他の各記号は前記定義の通りである。)

15 工程 15

化合物 [20] (製法 6 において化合物 [16] を得るのと同様の方法にて得ることができる) を化合物 [21] とアミド縮合させることにより化合物 [I]-9 を得ることができる。アミド縮合は常法に従って行うことができる。例えば、 R^D がカルボキシ基である場合には、 N, N -ジメチルホルムアミド、アセトニトリル、テトラヒドロフラン、クロロホルム、酢酸エチル、塩化メチレン、トルエン等の溶媒中、ジシクロヘキシルカルボジイミド、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド・塩酸塩、ジフェニルホスホリルアジド等の縮合剤の存在下で、また、 N -ヒドロキシスクシンイミド、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール等の存在下又は非存在下で縮合させる方法が挙げられる。反応は冷却下乃至加熱下にて行うことができる。一方、 R^D がハロゲン原子で置換されたホルミル基である場合には、例えば、 N, N -ジメチルホルムアミド、アセトニトリル、テトラヒドロフラン、クロロホルム、酢酸エチル、塩

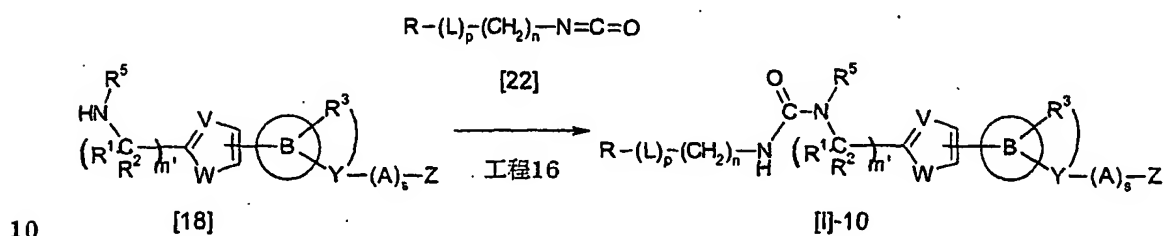
20

25

化メチレン、トルエン、水等、又はそれらの混合溶媒の溶媒中、無機塩基（炭酸水素ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素カリウム、水酸化ナトリウム等）や有機塩基（トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、ピリジン等）の塩基存在下で縮合させる方法が挙げられる。反応は冷却下乃至加熱下にて行うことができる。

製法 9

本製法は、 m が 1 又は 2 であり、 X が $-NH-CO-N(R^5)-$ である化合物 [I] を製造する方法である。



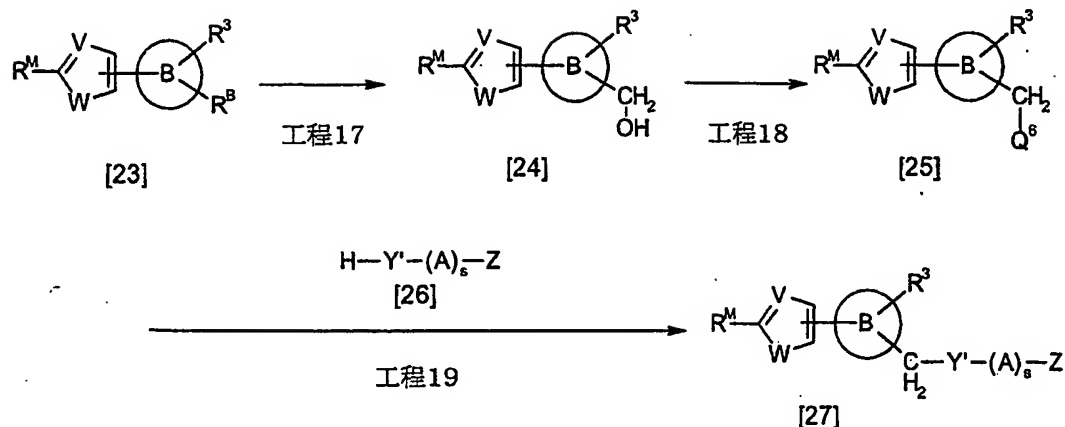
(式中、各記号は前記定義の通りである。)

工程 16

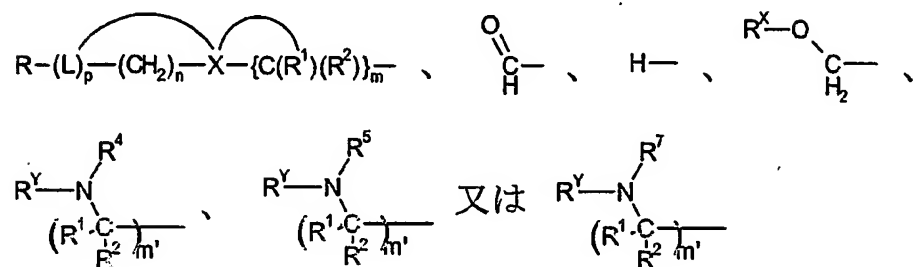
化合物 [18] を溶媒中、塩基の存在下又は非存在下で化合物 [22] と反応させることにより、化合物 [I]-10 を得ることができる。溶媒としては、 N,N -ジメチルアセトアミド、 N,N -ジメチルホルムアミド、アセトニトリル、酢酸エチル、トルエン、エーテル系溶媒（テトラヒドロフラン、ジオキサン等）、ハロゲン系溶媒（クロロホルム、ジクロロメタン等）等、又はそれらの混合溶媒が挙げられる。塩基としては、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム等の無機塩基類、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン等の有機塩基類が挙げられる。反応は冷却下乃至加熱下にて行うことができる。

製法 10

本製法は、化合物 [I] か、又は製法 1、3 及び 4 で使用する化合物 [1]、製法 1 で使用する化合物 [2]、製法 1 で使用する化合物 [3] 若しくは製法 6 で使用する化合物 [15] のうち、 Y が $-CH_2-N(R^{12})-$ 、 $-CH_2-O-$ 又は $-CH_2-S-$ である化合物を製造する方法である。



(式中、 R^M は



- (式中、各記号は前記定義の通りである)を示し、 R^B はカルボキシ基、
- 5 アルキル基(メチル基、エチル基等)で置換されたカルボキシ基又はホルミル基を示し、 Q^6 は製法1のごとく一般的な脱離基を示し、 Y' は $-N(R^{12})-$ 、 $-O-$ 又は $-S-$ (式中、各記号は前記定義の通りである)を示し、その他の各記号は前記定義の通りである。)

工程 17

- 10 化合物[23]を溶媒中、必要により活性化剤で活性化させた後、通常の還元剤を用いる還元法により化合物[24]を得ることができる。溶媒としては、アルコール類(メタノール、エタノール等)、エーテル系溶媒(テトラヒドロフラン、ジオキサン等)、トルエン等、又はそれらの混合溶媒が挙げられる。還元剤としては、水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ
- 15 素リチウム、ジボラン、水素化アルミニウムリチウム等が挙げられる。活性化剤としては、例えば、 R^B がカルボキシ基である場合にはカルボニルジイミダゾール等が挙げられる。反応は冷却下乃至加熱下にて行うことができる。

工程 18

- 化合物[24]の水酸基を、常法に従って一般的な脱離基に置換することにより、化合物[25]を得ることができる。例えば、メシルオキシ基、トシルオキシ基等への変換は、溶媒中、有機塩基存在下、かかるスルホンクロリドを用いることにより行うことができる。溶媒としてはトルエン、酢酸エチル、ハロゲン系溶媒（クロロホルム、ジクロロメタン等）、エーテル系溶媒（テトラヒドロフラン、ジオキサン等）、アセトニトリル、N, N-ジメチルホルムアミドまたはこれらの混合溶媒が挙げられ、有機塩基としてはピリジン、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン等が挙げられる。反応は冷却下乃至加熱下にて行うことができる。
- 10 一方、塩素原子への変換は、無溶媒又は溶媒中、塩化チオニルを用いることにより行うことができる。溶媒としてはトルエン、酢酸エチル、ハロゲン系溶媒（クロロホルム、ジクロロメタン等）、エーテル系溶媒（テトラヒドロフラン、ジオキサン等）、またはこれらの混合溶媒が挙げられ、触媒としてN, N-ジメチルホルムアミドを添加しても構わない。反応は冷却下乃至加熱下にて行うことができる。また、塩素原子への変換は、メシルオキシ基、トシルオキシ基等へ変換した後、さらにアルカリ金属塩化物（塩化リチウム等）あるいは4級アンモニウム塩化物と反応させることにより行うこともできる。溶媒としては、アセトニトリル、N, N-ジメチルホルムアミド等が挙げられる。反応は冷却下乃至加熱下にて行うことができる。
- 20

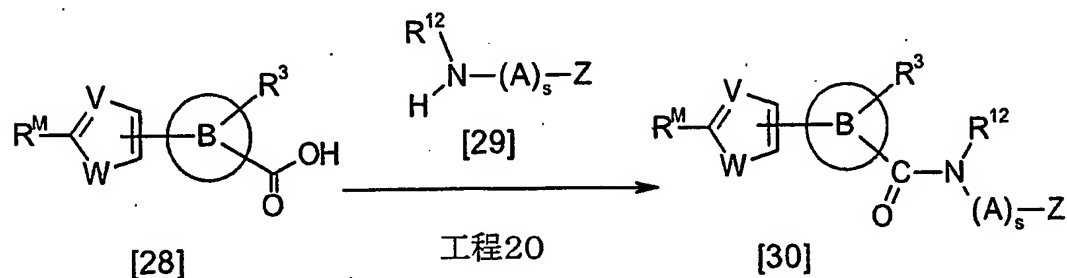
工程 19

- 化合物[25]を溶媒中、塩基の存在下、触媒の存在下又は非存在下で化合物[26]と反応させることにより、化合物[27]を得ることができる。溶媒としては、N, N-ジメチルアセトアミド、N, N-ジメチルホルムアミド、アセトニトリル、酢酸エチル、トルエン、アルコール系溶媒（メタノール、エタノール等）、エーテル系溶媒（テトラヒドロフラン、ジオキサン等）、ハロゲン系溶媒（クロロホルム、ジクロロメタン等）等、又はそれらの混合溶媒が挙げられる。塩基としては、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム等の無機塩基類、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、カリウム *tert*-ブトキシド等の有機塩基類が挙げられる。
- 25
- 30 触媒としては、ヨウ化カリウム、4級アンモニウム塩（ヨウ化テトラブチルアンモニウム、臭化テトラブチルアンモニウム等）等が挙げられる。

反応は室温乃至加熱下にて行うことができる。

製法 1 1

- 本製法は、化合物[I]か、又は製法 1、3 及び 4 で使用する化合物[1]、製法 1 で使用する化合物[2]、製法 1 で使用する化合物[3]若しくは製法 5 6 で使用する化合物[15]のうち、Y が $-\text{CO}-\text{N}(\text{R}^{12})-$ である化合物を製造する方法である。



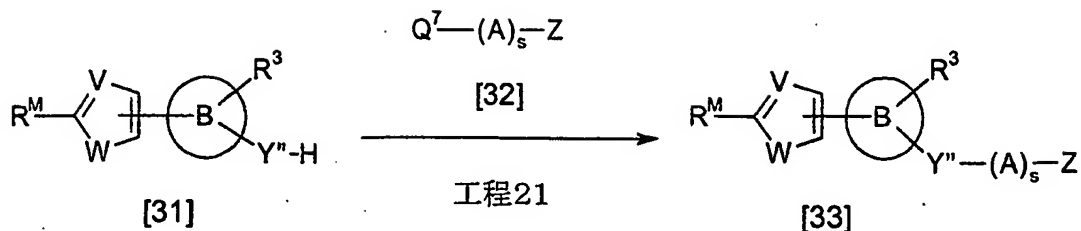
(式中、各記号は前記定義の通りである。)

10 工程 2 0

- 化合物[28]を化合物[29]とアミド縮合させることにより化合物[30]を得ることができる。アミド縮合は常法に従って行うことができる。例えば、N, N-ジメチルホルムアミド、アセトニトリル、テトラヒドロフラン、クロロホルム、酢酸エチル、塩化メチレン、トルエン等の溶媒中、ジシクロヘキシルカルボジイミド、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド・塩酸塩、ジフェニルホスホリルアジド等の縮合剤の存在下で、また、N-ヒドロキシスクシンイミド、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール等の存在下又は非存在下で縮合させる方法が挙げられる。反応温度は0℃～100℃が好適である。

20 製法 1 2

本製法は、化合物[I]か、又は製法 1、3 及び 4 で使用する化合物[1]、製法 1 で使用する化合物[2]、製法 1 で使用する化合物[3]若しくは製法 6 で使用する化合物[15]のうち、Y が $-\text{N}(\text{R}^{11})-$ 、 $-\text{O}-$ 又は $-\text{S}-$ である化合物を製造する方法である。



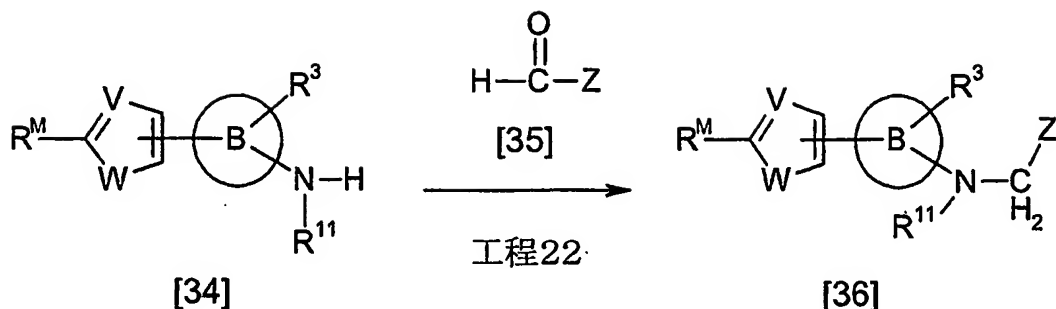
(式中、 Q^7 は製法1のごとく一般的な脱離基を示し、 Y'' は $\text{---N(R}^{11}\text{)}$ 、 ---O--- 又は ---S--- を示し、その他の各記号は前記定義の通りである。)

工程21

化合物[31]を溶媒中、塩基の存在下、触媒の存在下又は非存在下で化合物[32]と反応させることにより、化合物[33]を得ることができる。溶媒としては、N，N-ジメチルアセトアミド、N，N-ジメチルホルムアミド、アセトニトリル、酢酸エチル、トルエン、アルコール系溶媒（メタノール、エタノール等）、エーテル系溶媒（テトラヒドロフラン、ジオキサン等）、ハロゲン系溶媒（クロロホルム、ジクロロメタン等）等、又はそれらの混合溶媒が挙げられる。塩基としては、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム等の無機塩基類、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン等の有機塩基類が挙げられる。触媒としては、ヨウ化カリウム、4級アンモニウム塩（ヨウ化テトラブチルアンモニウム、臭化テトラブチルアンモニウム等）等が挙げられる。反応は室温乃至加熱下にて行うことができる。

製法13

本製法は、化合物[I]か、又は製法1、3及び4で使用する化合物[1]、製法1で使用する化合物[2]、製法1で使用する化合物[3]若しくは製法6で使用する化合物[15]のうち、Yが $\text{---N(R}^{11}\text{)}$ であり、sが1であり、Aがメチレン基である化合物を製造する方法である。



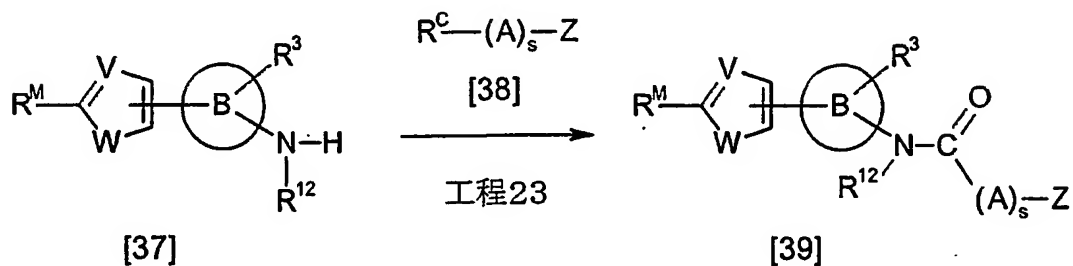
(式中、各記号は前記定義の通りである。)

工程 2 2

化合物[34]を溶媒中、還元剤の存在下で化合物[35]と反応させること
 5 により、化合物[36]を得ることができる。溶媒としては、N，N－ジメ
 チルアセトアミド、N，N－ジメチルホルムアミド、アセトニトリル、
 酢酸エチル、トルエン、エーテル系溶媒（テトラヒドロフラン、ジオキ
 サン等）、ハロゲン系溶媒（クロロホルム、ジクロロメタン等）、酢酸等、
 又はそれらの混合溶媒が挙げられる。還元剤としては、トリアセトキシ
 10 水素化ホウ素ナトリウム、水素化シアノホウ素ナトリウム等が挙げられ
 る。反応温度は0℃～80℃が好適である。

製法 1 4

本製法は、化合物[I]か、又は製法1、3及び4で使用する化合物[1]、
 製法1で使用する化合物[2]、製法1で使用する化合物[3]若しくは製法
 15 6で使用する化合物[15]のうち、Yが－N(R¹²)－CO－である化合物
 を製造する方法である。



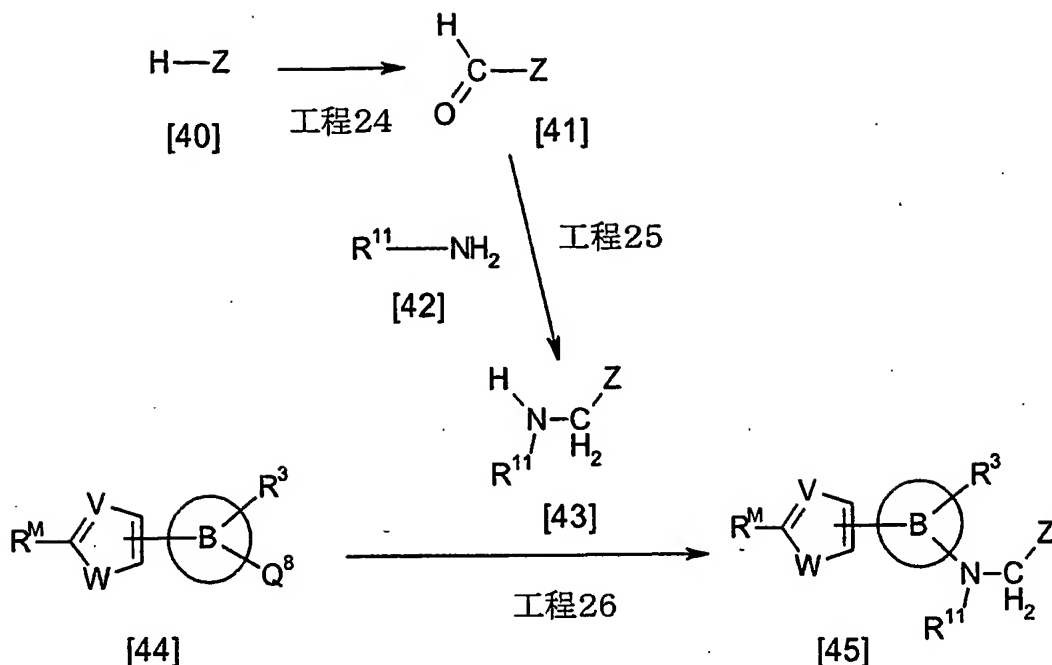
(式中、R^cはカルボキシ基又はハロゲン原子（臭素原子、ヨウ素原子、
 20 フッ素原子、塩素原子等）で置換されたホルミル基を示し、その他の各
 記号は前記定義の通りである。)

工程 2 3

化合物[37]を化合物[38]とアミド縮合させることにより化合物[39]を得ることができる。アミド縮合は常法に従って行うことができる。例えば、 R^c がカルボキシ基である場合には、N, N-ジメチルホルムアミド、アセトニトリル、テトラヒドロフラン、クロロホルム、酢酸エチル、塩化メチレン、トルエン等の溶媒中、ジシクロヘキシルカルボジイミド、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド・塩酸塩、ジフェニルホスホリルアジド等の縮合剤存在下で、また、N-ヒドロキシスクシンイミド、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール等の存在下又は非存在下で縮合させる方法が挙げられる。一方、 R^c がハロゲン原子で置換されたホルミル基である場合には、例えば、N, N-ジメチルホルムアミド、アセトニトリル、テトラヒドロフラン、クロロホルム、酢酸エチル、塩化メチレン、トルエン、水等、又はそれらの混合溶媒の溶媒中、無機塩基（炭酸水素ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素カリウム、水酸化ナトリウム等）や有機塩基（トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、ピリジン等）の塩基存在下で縮合させる方法が挙げられる。反応は冷却下乃至加熱下にて行うことができる。

製法 15

本製法は、化合物[I]か、又は製法 1、3 及び 4 で使用する化合物[1]、製法 1 で使用する化合物[2]、製法 1 で使用する化合物[3]若しくは製法 6 で使用する化合物[15]のうち、Yが-N(R^{11})-であり、sが1であり、Aがメチレン基である化合物を製造する方法である。



(式中、 Q^8 は製法1のごとく一般的な脱離基を示し、その他の各記号は前記定義の通りである。)

5 工程24

化合物[40]に、常法に従ってホルミル基を導入することにより、化合物[41]を得ることができる。例えば、 Z がアリール基又は芳香族ヘテロ環基（当該アリール基又は芳香族ヘテロ環基は前記記載の通り置換されていてもよい）である場合には、溶媒中、 Lewis 酸の存在下で化合物[40]をジクロロメチルメチルエーテルと反応させ、得られるメトキシジクロロメチル化合物を加水分解することにより化合物[41]を合成することができる。溶媒としては、ハロゲン系溶媒（クロロホルム、ジクロロメタン等）等が挙げられる。 Lewis 酸としては、塩化アルミニウム、四塩化チタン、四塩化スズ等が挙げられる。反応は冷却下乃至室温にて行うことができる。

工程25

化合物[41]を溶媒中、還元剤の存在下で化合物[42]と反応させることにより、化合物[43]を得ることができる。溶媒としては、 N ， N -ジメチルアセトアミド、 N ， N -ジメチルホルムアミド、アセトニトリル、酢酸エチル、トルエン、エーテル系溶媒（テトラヒドロフラン、ジオキ

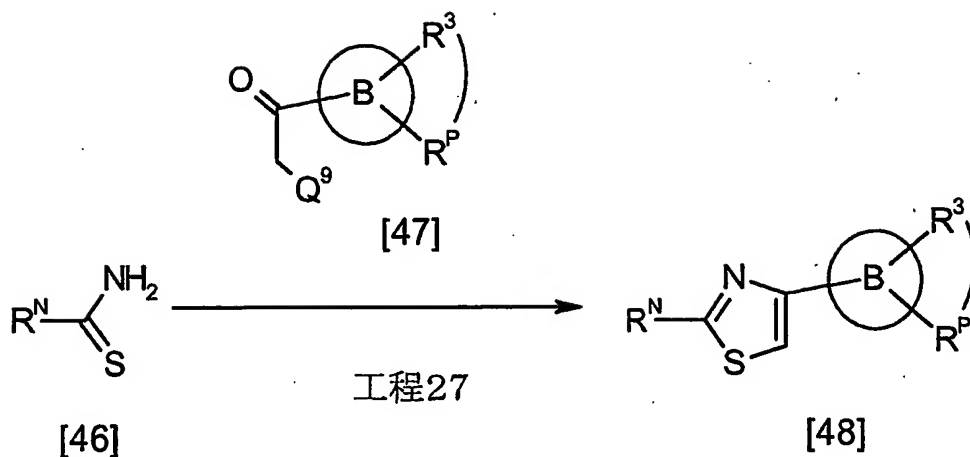
サン等)、ハロゲン系溶媒(クロロホルム、ジクロロメタン、1, 2-ジクロロエタン等)、アルコール系溶媒(メタノール、エタノール等)、酢酸等、又はそれらの混合溶媒が挙げられる。還元剤としては、水素化ホウ素ナトリウム、トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウム、水素化シア
5 ノホウ素ナトリウム等が挙げられる。反応温度は0℃~80℃が好適である。

工程 26

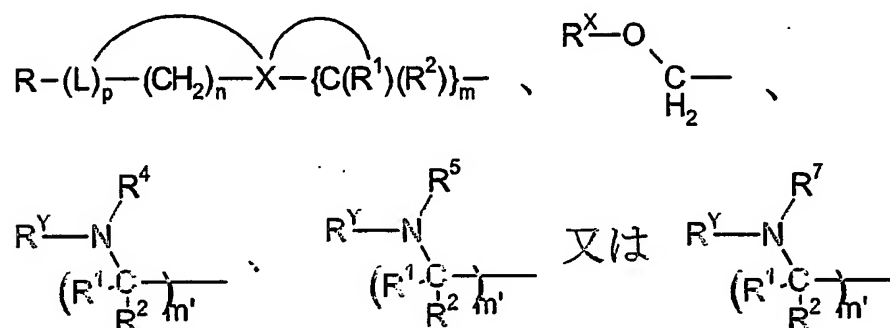
化合物[43]を溶媒中、塩基の存在下、触媒の存在下で化合物[44]と反応させることにより、化合物[45]を得ることができる。溶媒としては、
10 トルエン、キシレン、エーテル系溶媒(テトラヒドロフラン、ジオキサン、1, 2-ジメトキシエタン等)等、又はそれらの混合溶媒が挙げられる。塩基としては、炭酸セシウム、ナトリウムtert-ブトキシド、リン酸三カリウム等が挙げられる。触媒としては、パラジウム錯体(例えば、酢酸パラジウム及び(R)-(+) - 2, 2'-ビス(ジフェニ
15 ルホスフィノ) - 1, 1'-ビナフチルを用いて形成される錯体)等が挙げられる。反応は室温乃至加熱下にて行うことができる。

製法 16

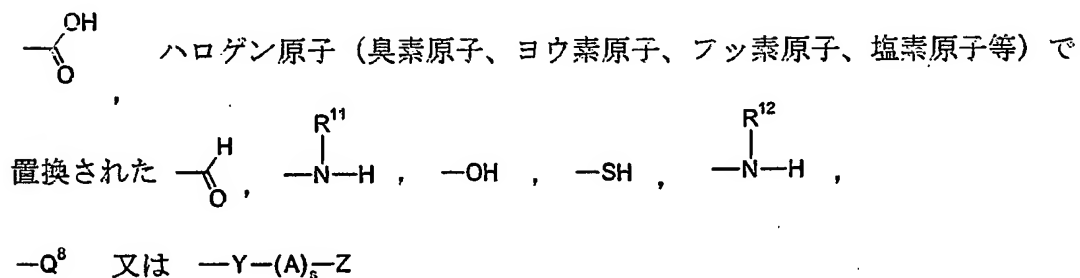
本製法は、化合物[I]か、又は製法1で使用する化合物[3]、製法6で使用する化合物[15]、製法10で使用する化合物[23]、製法11で使用する化合物[28]、製法12で使用する化合物[31]、製法13で使用する化合物[34]、製法14で使用する化合物[37]若しくは製法15で使用する化合物[44]のうち、Vが=N-であり、Wが-S-であり、前記のV及びWが構成するチアゾール環上におけるBの置換位置が4位である化合物を製造する方法である。



(式中、 R^N は



5 (式中、各記号は前記定義の通りである)を示し、 R^P は



(式中、各記号は前記定義の通りである)を示し、 Q^9 は製法1記載のごとく一般的な脱離基を示し、その他の各記号は前記定義の通りである。)

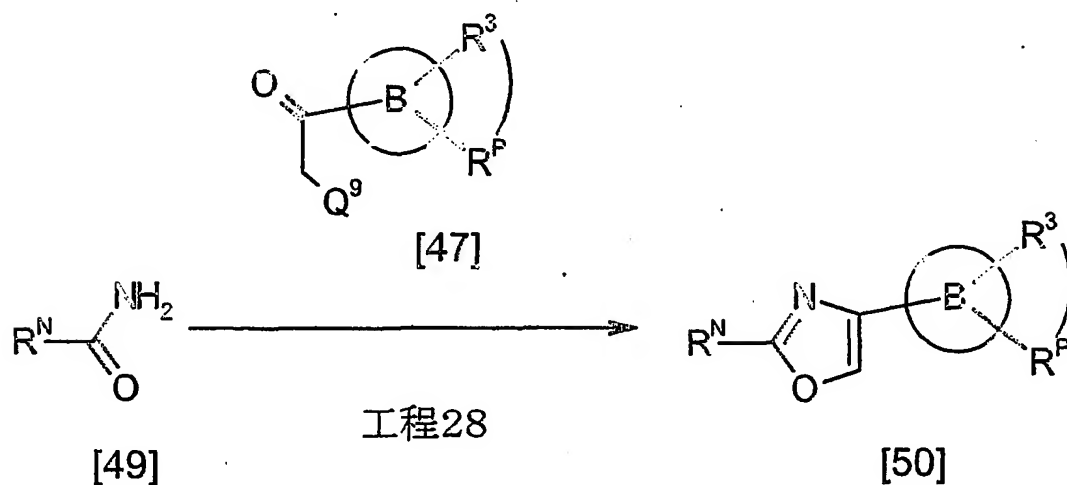
10 工程27

化合物[46]を溶媒中、塩基の存在下又は非存在下で化合物[47]と反応させることにより、化合物[48]を得ることができる。溶媒としては、N,N-ジメチルアセトアミド、N,N-ジメチルホルムアミド、アセトニ

トリル、酢酸エチル、アルコール系溶媒（メタノール、エタノール等）、エーテル系溶媒（テトラヒドロフラン、ジオキサン等）、ハロゲン系溶媒（クロロホルム、ジクロロメタン等）等、又はそれらの混合溶媒が挙げられる。塩基としては、炭酸水素ナトリウム等の無機塩基類、ジイソプロピルエチルアミン等の有機塩基類が挙げられる。反応は冷却下乃至加熱下にて行うことができる。

製法 17

本製法は、化合物[I]か、又は製法 1 で使用する化合物[3]、製法 6 で使用する化合物[15]、製法 10 で使用する化合物[23]、製法 11 で使用する化合物[28]、製法 12 で使用する化合物[31]、製法 13 で使用する化合物[34]、製法 14 で使用する化合物[37]若しくは製法 15 で使用する化合物[44]のうち、V が=N-であり、W が-O-であり、前記のV及びWが構成するオキサゾール環上におけるBの置換位置が4位である化合物を製造する方法である。



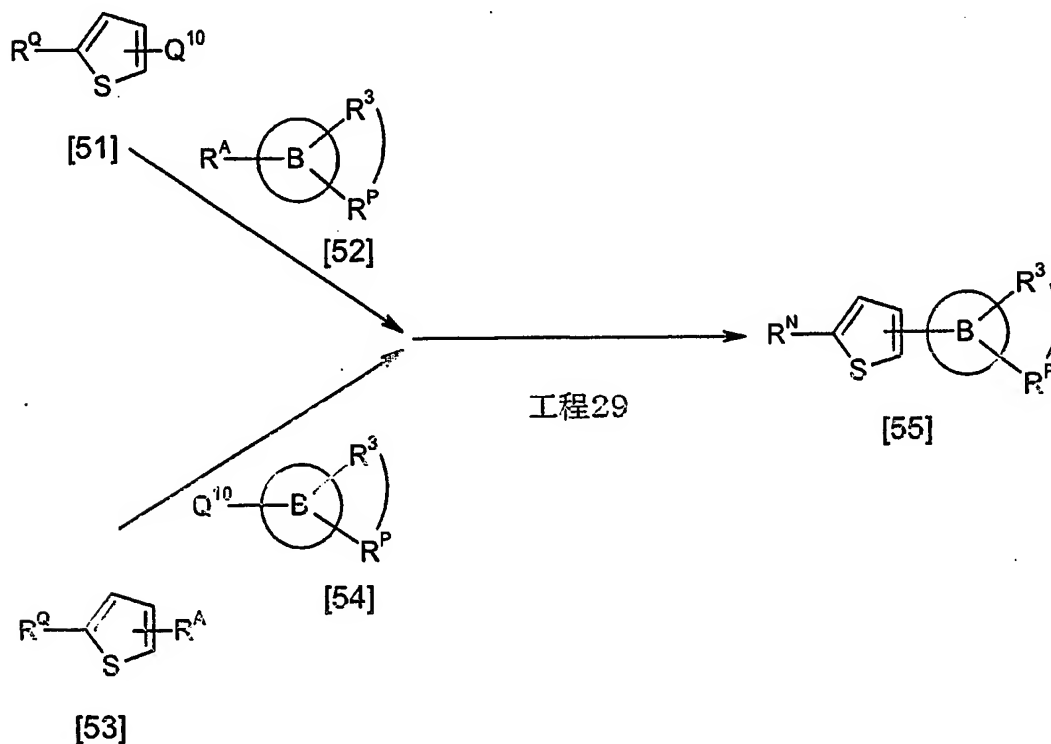
（式中、各記号は前記定義の通りである。）

工程 28

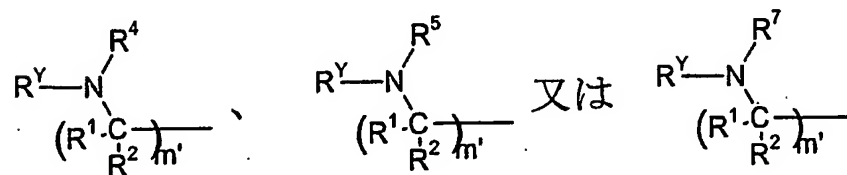
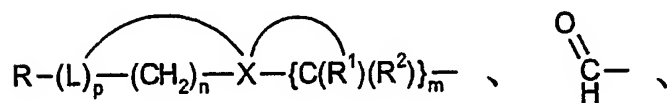
化合物[49]を無溶媒又は溶媒中、化合物[47]と反応させることにより、化合物[50]を得ることができる。溶媒としては、アセトニトリル、アルコール類（メタノール、エタノール、イソプロピルアルコール等）、キシレン、トルエン等、又はそれらの混合溶媒が挙げられる。反応は加熱下で行うことができる。

製法 18

本製法は、化合物[I]か、又は製法 1、3 及び 4 で使用する化合物[1]、製法 6 で使用する化合物[15]、製法 10 で使用する化合物[23]、製法 11 で使用する化合物[28]、製法 12 で使用する化合物[31]、製法 13 で使用する化合物[34]、製法 14 で使用する化合物[37]若しくは製法 15 で使用する化合物[44]のうち、V が =CH- であり、W が -S- である化合物[I]を製造する方法である。



10 (式中、 R^Q は



(式中、各記号は前記定義の通りである)を示し、 Q^{10} は製法 1 のごとく

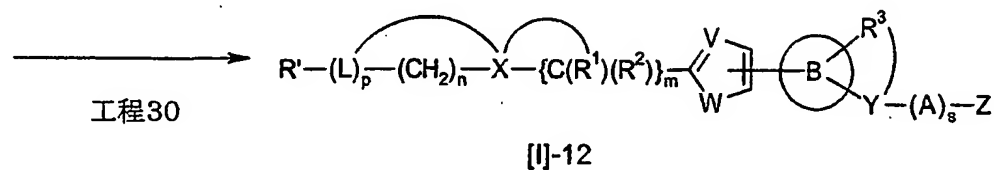
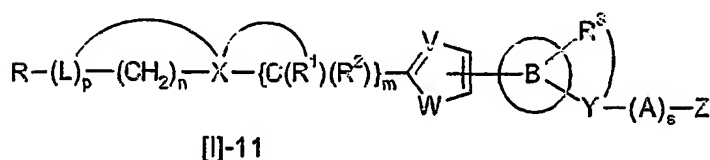
一般的な脱離基を示し、 R^A はボロン酸基 ($-B(OH)_2$) を示し、その他の各記号は前記定義の通りである。)

工程 2 9

- 溶媒中、塩基の存在下、触媒の存在下で、化合物[51]と化合物[52]とを、又は化合物[53]と化合物[54]とを反応させることにより、化合物[55]を得ることができる。溶媒としては、N, N-ジメチルホルムアミド、アセトニトリル、アルコール系溶媒 (メタノール、エタノール等)、エーテル系溶媒 (テトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシエタン等)、トルエン、水等、又はそれらの混合溶媒が挙げられる。塩基としては、炭酸カリウム、炭酸水素カリウム、炭酸水素ナトリウム、リン酸カリウム等の無機塩基類、トリエチルアミン等の有機塩基類が挙げられる。触媒としては、パラジウム触媒 (テトラキス (トリフェニルホスフィン) パラジウム、ビス (トリフェニルホスフィン) パラジウム (II) ジクロリド、酢酸パラジウム-トリフェニルホスフィン等) 等が挙げられる。
- 反応は室温乃至加熱下にて行うことができる。

製法 1 9

本製法は、 R が $-COOH$ 、 $-A^1-COOH$ 又は $-O-A^1-COOH$ である化合物[I]を製造する方法である。



(式中、 R' は $-COOH$ 、 $-A^1-COOH$ 又は $-O-A^1-COOH$ を示し、その他の各記号は前記定義の通りである。)

工程 3 0

- 化合物[I]-11 の R における R^{19} が C_{1-4} アルキル基である場合には、常法に従って脱保護を行うことによりカルボン酸に導き、化合物[I]-12 を

得ることができる。例えば、溶媒中、塩基の存在下で加水分解する方法が挙げられる。溶媒としては、アルコール類（メタノール、エタノール、イソプロピルアルコール等）、テトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシエタン、N, N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、水等、
5 又はそれらの混合溶媒が挙げられる。塩基としては、水酸化ナトリウム等のアルカリ金属水酸化物類、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム等が挙げられる。反応は冷却下乃至加熱下にて行うことができる。

さらに、上記製法で得られた化合物〔I〕を溶媒中、酸又は塩基を加えて攪拌することにより、化合物〔I〕の医薬上許容し得る塩を得ることができる。溶媒としては、2-ブタノン、アセトン、テトラヒドロフラン、酢酸エチル、メタノール、エタノール、水、ヘキサン、又はそれらの混合溶媒が挙げられる。酸としては、塩酸、硫酸、リン酸等の無機酸類、シュウ酸、マロン酸、トリフルオロ酢酸、メタンスルホン酸、p-
10 トルエンスルホン酸、ベンゼンスルホン酸等の有機酸が挙げられる。塩基としては、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム等の無機塩基、トリエチルアミン、エチレンジアミン、トリス（ヒドロキシメチル）アミノメタン、N-メチル-D-グルカミン等の有機塩基が挙げられる。反応は室温で行うことができる。

上記で得られた化合物〔I〕又はその医薬上許容し得る塩を溶媒中、
20 室温乃至加熱下にて溶解又は懸濁させ、0℃～150℃にて攪拌又は静置することにより結晶を析出させて、冷却下乃至室温にて必要に応じて当該化合物又はその塩の貧溶媒を加えた上濾過することにより、化合物〔I〕又はその医薬上許容し得る塩の結晶を得ることができる。溶媒としては、2-ブタノン、アセトン、テトラヒドロフラン、酢酸エチル、
25 メタノール、エタノール、水、ヘキサン、又はそれらの混合溶媒が挙げられる。

なお、本明細書で記載した製造方法は、本発明化合物の製造方法の一例であり、有機合成化学の分野で公知の常法を組み合わせることにより、上記で説明した以外の化合物についても製造することができる。

30

実施例

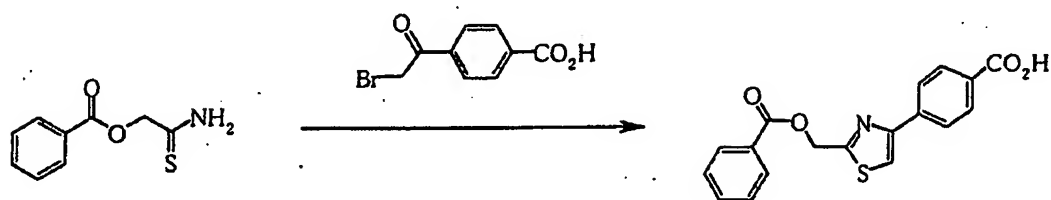
次に本発明に係る一般式〔I〕で示される化合物及びその製造方法を実施例によって、具体的に説明するが、本発明はこれらの実施例によっ

て限定されるものではない。

実施例 1-1

5 5-〔4-〔4-〔〔4-(1-エチルプロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ〕-メチル〕-フェニル〕-チアゾール-2-イルメトキシ〕-ニコチン酸

(1) 4-(2-(ベンゾイルオキシメチル)チアゾール-4-イル)安息香酸



4-(プロモアセチル)安息香酸(10 g、41.14 mmol)の
10 N,N-ジメチルホルムアミド(40 ml)溶液に、氷冷下2-(ベン
ゾイルオキシ)エタンチオアミド(8.03 g、41.14 mmol)
を加え、室温にて1.5時間攪拌した。反応終了後、氷冷下炭酸水素ナ
トリウム(3.46 g、41.14 mmol)、水を加え、室温にて0.
5時間攪拌した後、析出物をろ取した。得られた固体を減圧下乾燥し標
15 題化合物(13.039 g、93.3%)を得た。

(2) 4-(4-ヒドロキシメチルフェニル)チアゾール-2-イル)
メチルベンゾエート

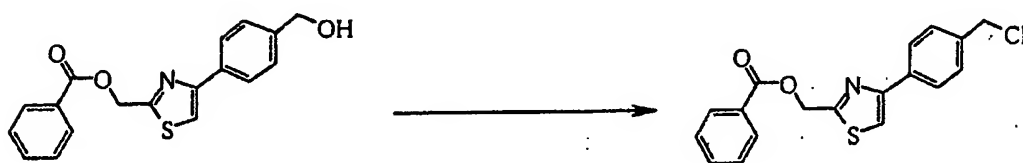


実施例 1-1 (1) で得られた 4-(2-(ベンゾイルオキシメチ
20 ル)チアゾール-4-イル)安息香酸(0.5 g、1.47 mmol)
のテトラヒドロフラン(5 ml)懸濁液に、室温下1,1'-カルボニ
ルジイミダゾール(0.358 g、2.21 mmol)を加え、65℃
で2時間攪拌した。続いて室温下水素化ホウ素ナトリウム(0.056

g、1.47 mmol) の水溶液を滴下し、同温にて20分攪拌した。反応終了後、酢酸エチル、炭酸水素ナトリウム水溶液を加え抽出し、有機層を水、飽和食塩水で洗浄した後、硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去した後、残渣をヘキサン-酢酸エチル混合溶媒で洗浄し取した。

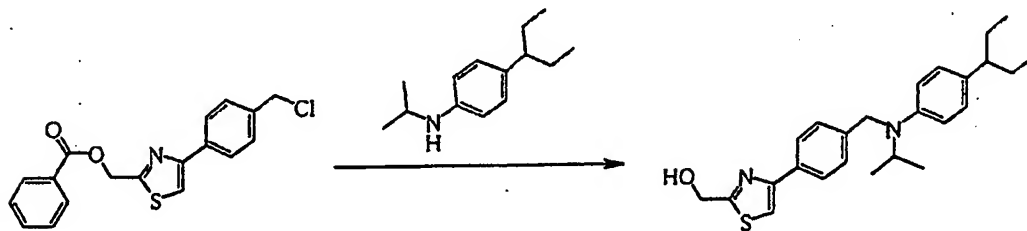
- 5 得られた固体を減圧下乾燥し標題化合物 (370.7 mg、77.5%) を得た。

(3) (4-(4-クロロメチルフェニル)チアゾール-2-イル)メチルベンゾエート



- 10 実施例1-1(2)で得られた(4-(4-ヒドロキシメチルフェニル)チアゾール-2-イル)メチルベンゾエート(5.55 g、17.06 mmol)のクロロホルム(100 ml)溶液に、氷冷下塩化チオニル(1.49 ml、20.67 mmol)、N,N-ジメチルホルムアミド(触媒量)を加え、室温下1時間攪拌した。反応終了後、溶媒を留去した残渣にクロロホルムを加え濃縮した後、ヘキサンを加え析出物をろ取した。得られた固体を減圧下乾燥し標題化合物(5.804 g、98.9%)を得た。

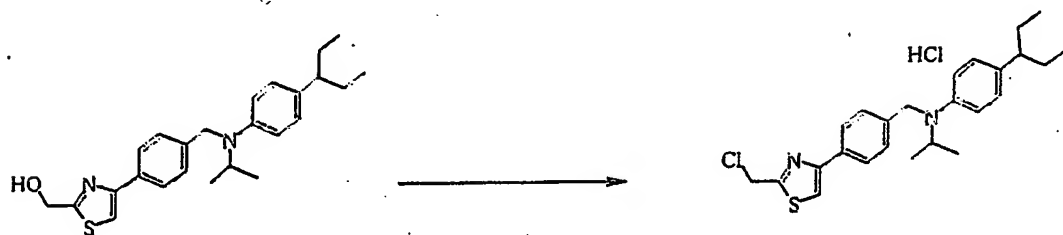
(4) (4-(4-(N-イソプロピル-4-(1-エチルプロピル)フェニルアミノ)メチルフェニル)チアゾール-2-イル)メタノール



20

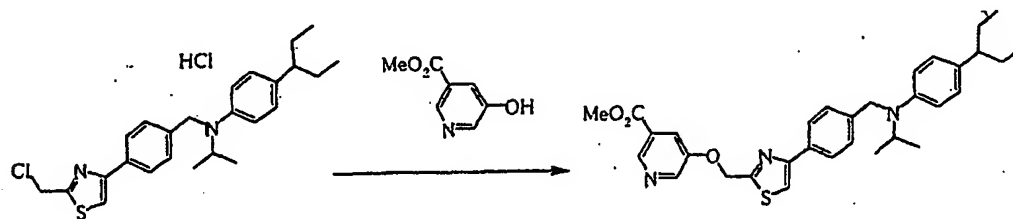
N-イソプロピル-4-(1-エチルプロピル)アニリン(7.34 g、35.78 mmol)のN,N-ジメチルアセトアミド(35 ml)溶液に、実施例1-1(3)で得られた(4-(4-クロロメチル

- フェニル) チアゾール-2-イル) メチル ベンゾエート (11.18 g, 32.52 mmol)、炭酸カリウム (4.95 g, 35.78 mmol)、ヨウ化カリウム (0.54 g, 3.25 mmol) を順次加え、80度で3時間攪拌後、炭酸カリウム (0.449 g, 3.252 mmol) を加え70℃で12時間攪拌した。反応終了後、50%酢酸エチル-ヘキサン混合溶液、水を加え抽出し、有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄した後、硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去して得られた残渣に、室温下テトラヒドロフラン (60 ml)、メタノール (60 ml)、1N-水酸化ナトリウム水溶液 (48.8 ml) を順次加えた後、70℃で1.5時間攪拌した。反応終了後、溶媒を留去し、酢酸エチル、水を加え抽出し、水、飽和食塩水で順次洗浄した後、有機層を硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去し得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン: 酢酸エチル = 4:1 → 2:1) にて精製し、標題化合物 (10.664 g, 80.3%) を得た。
- (5) (4-(4-(N-イソプロピル-4-(1-エチルプロピル)フェニルアミノ)メチルフェニル)チアゾール-2-イル)メチルクロライド塩酸塩



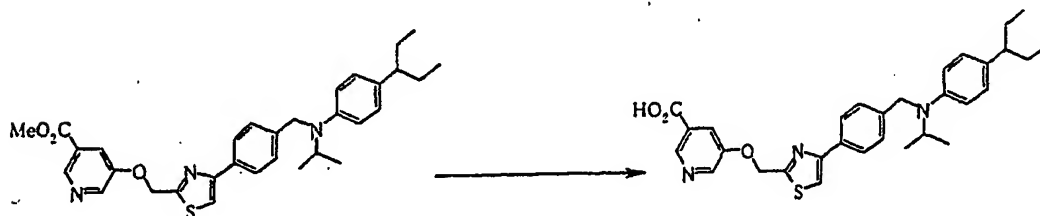
- 室温下クロロホルム (30 ml) に塩化チオニル (2.7 ml, 37.1 mmol)、N,N-ジメチルホルムアミド (触媒量) を加えた後、実施例1-1(4)で得られた (4-(4-(N-イソプロピル-4-(1-エチルプロピル)フェニルアミノ)メチルフェニル)チアゾール-2-イル)メタノール (10.1 g, 24.7 mmol) のクロロホルム (30 ml) 溶液を氷冷下滴下した。室温下1時間攪拌した。反応終了後、溶媒を留去した残渣にクロロホルムを加え濃縮した後、酢酸エチルを加え0.5時間攪拌した。析出物をろ取した後、得られた固体を減圧下乾燥し標題化合物 (10.23 g, 89.4%) を得た。

(6) 5 - { 4 - [4 - ({ [4 - (1 - エチル - プロピル) - フェニル] - イソプロピル - アミノ } - メチル) - フェニル] - チアゾール - 2 - イルメトキシ } - ニコチン酸 メチルエステル



- 5 実施例 1 - 1 (5) で得られた (4 - (4 - (N - イソプロピル - 4 - (1 - エチル - プロピル) フェニルアミノ) メチルフェニル) チアゾール - 2 - イル) メチルクロライド塩酸塩 (9 . 9 2 g , 2 1 . 4 m m o l) 、 5 - ヒドロキシニコチン酸メチル (3 . 6 1 g , 2 3 . 5 m m o l) の N , N - ジメチルホルムアミド溶液に、氷冷下炭酸カリウム (6 . 8 g , 4 9 . 2 m m o l) 、 ヨウ化カリウム (0 . 3 5 5 g , 2 . 1 4 m m o l) を加え、 6 0 ° C で 1 2 時間攪拌した。反応終了後、酢酸エチル、水を加え抽出し、有機層を水、飽和食塩水にて順次洗浄した後、硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン : 酢酸エチル = 8 : 1) 続いて (クロロホルム : 酢酸エチル = 2 0 : 1) にて精製し、標題化合物 (5 . 3 2 g , 4 5 . 7 %) を得た。

(7) 5 - { 4 - [4 - ({ [4 - (1 - エチル - プロピル) - フェニル] - イソプロピル - アミノ } - メチル) - フェニル] - チアゾール - 2 - イルメトキシ } - ニコチン酸



- 20 実施例 1 - 1 (6) で得られた 5 - { 4 - [4 - ({ [4 - (1 - エチル - プロピル) - フェニル] - イソプロピル - アミノ } - メチル) - フェニル] - チアゾール - 2 - イルメトキシ } - ニコチン酸 メチルエステル (5 . 3 2 g , 9 . 7 8 m m o l) の 5 0 % テトラヒドロフラン -

メタノール (32 ml) 溶液に、室温下 2 N-水酸化ナトリウム水溶液 (9.78 ml) を加え、75℃で2時間攪拌した。反応終了後、氷冷下 2 N-塩酸 (9.78 ml) を加え、析出物をろ取した。得られた固体を減圧下乾燥し標題化合物 (5.00 g、96.5%) を得た。

- 5 ¹H NMR (DMSO-d₆, 300 MHz) δ 0.69 (t, J = 7.3 Hz, 6 H), 1.16 (d, J = 6.5 Hz, 6 H), 1.48- 1.31 (m, 2 H), 1.64- 1.48 (m, 2 H), 2.19- 2.06 (m, 1 H), 4.23 (quint, J = 6.6 Hz, 1 H), 5.67 (s, 2 H), 6.62 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 6.89 (d, J = 8.6 Hz, 2 H), 7.36 (d, J = 8.2 Hz, 2 H), 7.90 (d, J = 8.2 Hz, 2 H), 7.99 (dd, J = 3.0, 1.5 Hz, 1 H), 8.11 (s, 1 H), 8.64 (d, J = 2.9 Hz, 1 H), 8.72 (d, J = 1.5 Hz, 1 H), 13.43 (br s, 1 H)
- 10

融点 201.5℃

実施例 1-2 乃至 1-186

- 実施例 1-1 と同様の方法により、また必要に応じその他常法を用いて、実施例 1-2 乃至 1-186 の化合物を製造した。得られた化合物の構造式及び物性値を、実施例 1-1 と併せて、以下の表に示した。
- 15

表 1-1

実施例	構造式	融点(°C)
1-1		201.5
1-2		219
1-3		177 - 181
1-4		135 - 138
1-5		161 - 163

表 1-2

実施例	構造式	融点(°C)
1-6		141 - 143
1-7		184 - 185
1-8		196 - 197
1-9		166 - 168

表 1-3

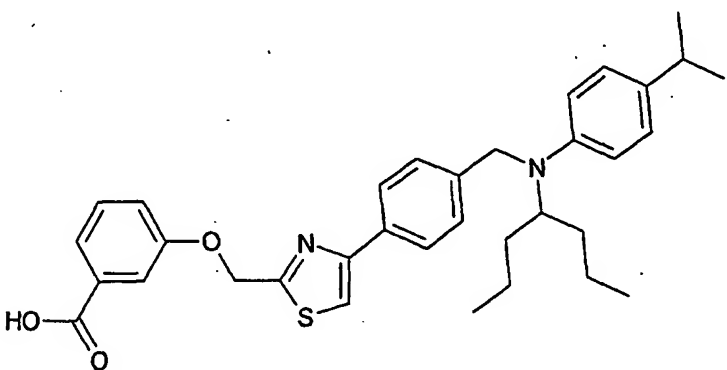
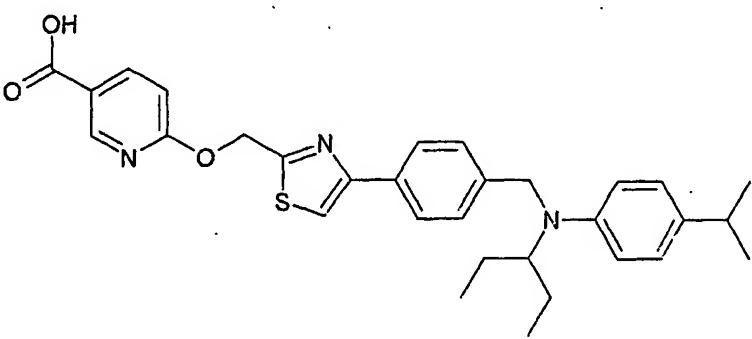
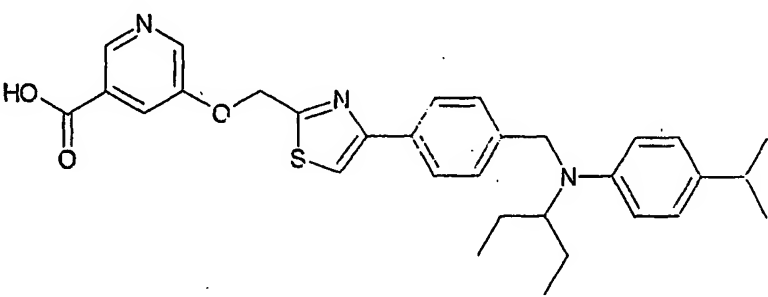
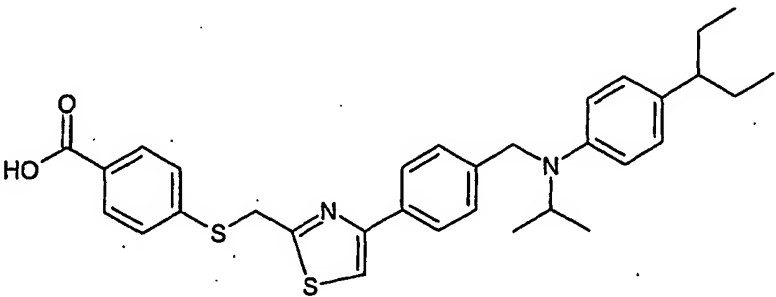
実施例	構造式	融点(°C)
1-10		127 - 129
1-11		155 - 157
1-12		110 - 114
1-13		132.5

表 1-4

実施例	構造式	融点(°C)
1-14		122 - 124
1-15		アモルファス
1-16		217 - 220
1-17		206 - 210

表 1-5

実施例	構造式	融点(°C)
1-18		190 - 192
1-19		110 - 113
1-20		150 - 153
1-21		アモルファス

表 1-6

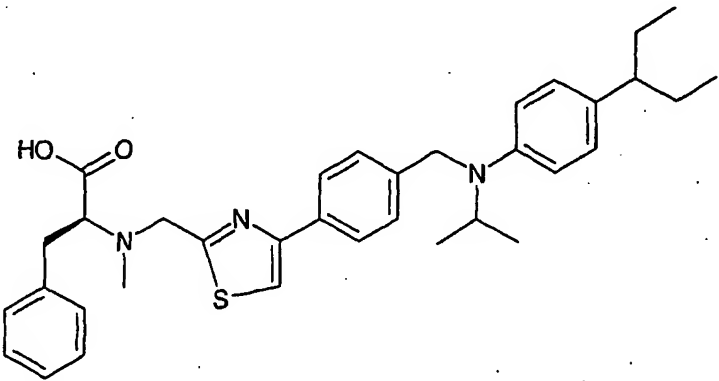
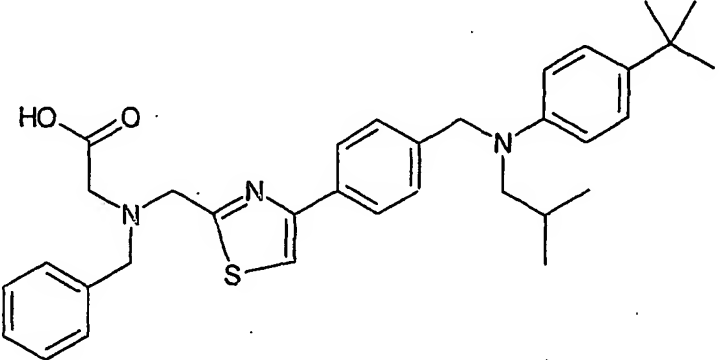
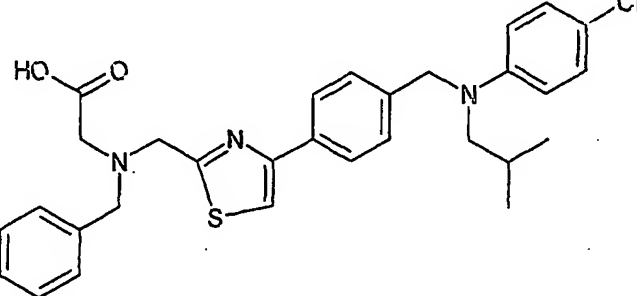
実施例	構造式	融点(°C)
1-22	 <chem>CC(C)C1=CC=C(C=C1)N(C1=CC=C(C=C1)CC2=CC=CC=C2C3=CN=C(C3)C4=CC=CC=C4C5C(C(=O)O)C(C6=CC=CC=C6)N5C4)C2</chem>	80
1-23	 <chem>CC(C)(C)C1=CC=C(C=C1)N(C1=CC=C(C=C1)CC2=CC=CC=C2C3=CN=C(C3)C4=CC=CC=C4C5C(C(=O)O)C(C6=CC=CC=C6)N5C4)C2</chem>	133
1-24	 <chem>CC(C)C1=CC=C(C=C1)N(C1=CC=C(C=C1)CC2=CC=CC=C2C3=CN=C(C3)C4=CC=CC=C4C5C(C(=O)O)C(C6=CC=CC=C6)N5C4)C2</chem>	152

表 1-7

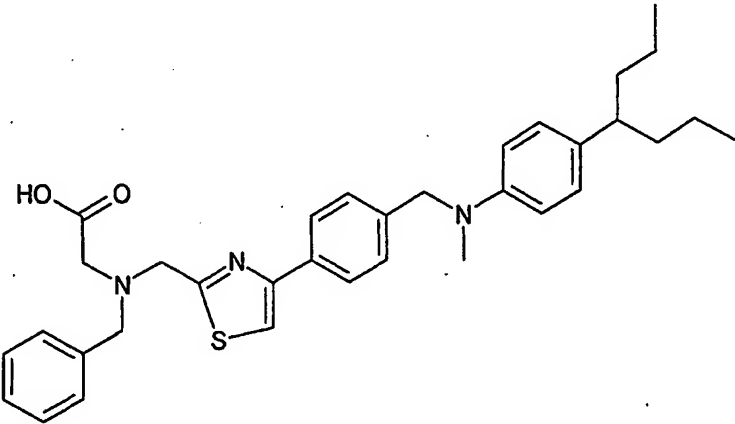
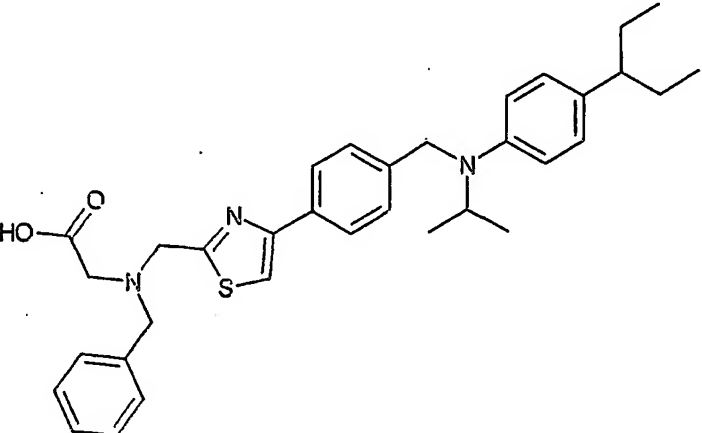
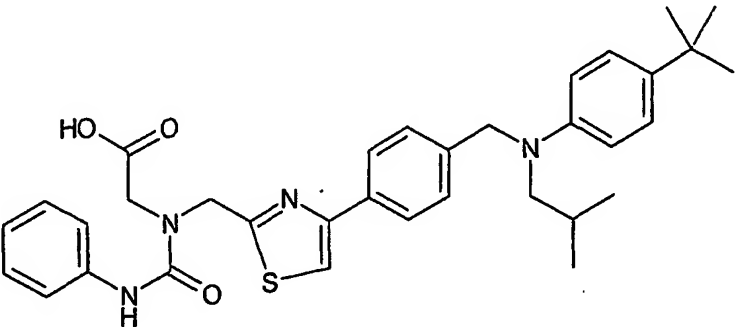
実施例	構造式	融点(°C)
1-25		138
1-26		アモルファス
1-27		119

表 1-8

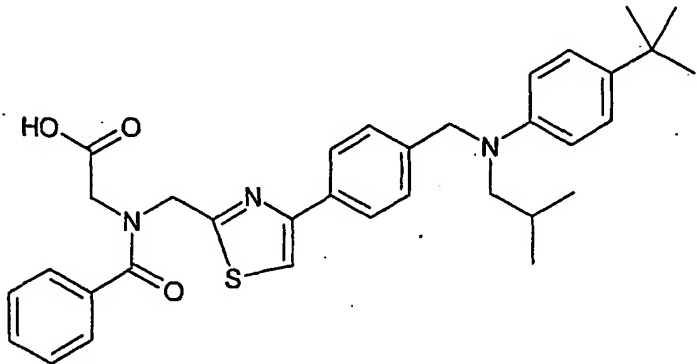
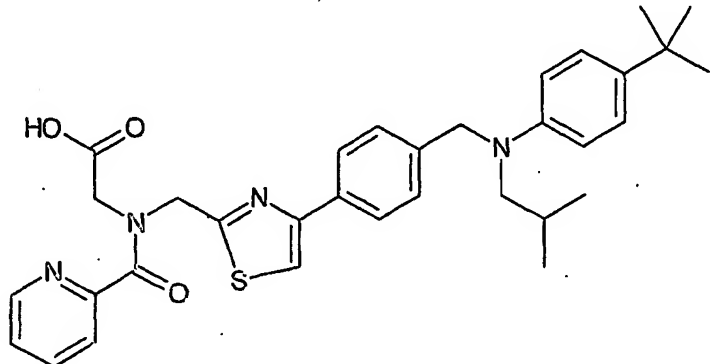
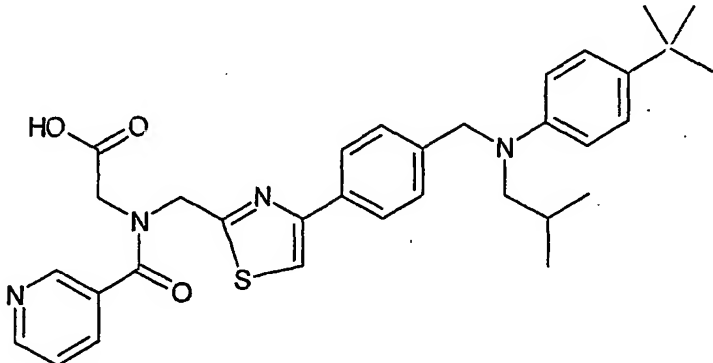
実施例	構造式	融点(°C)
1-28		147
1-29		160
1-30		193

表 1-9

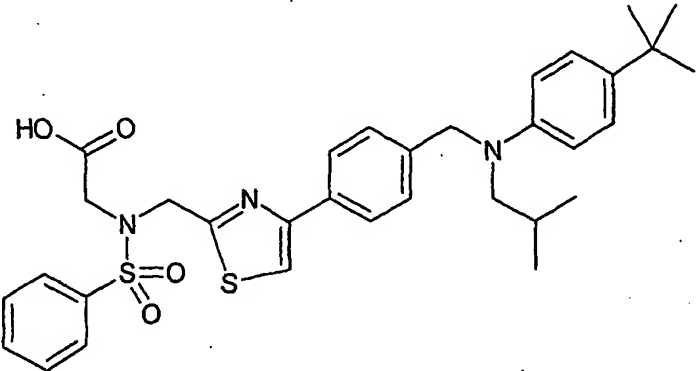
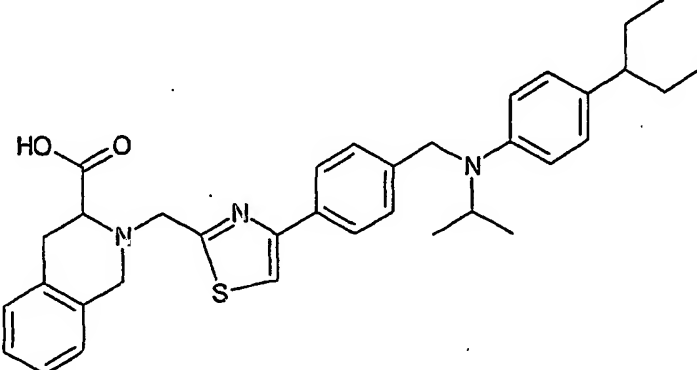
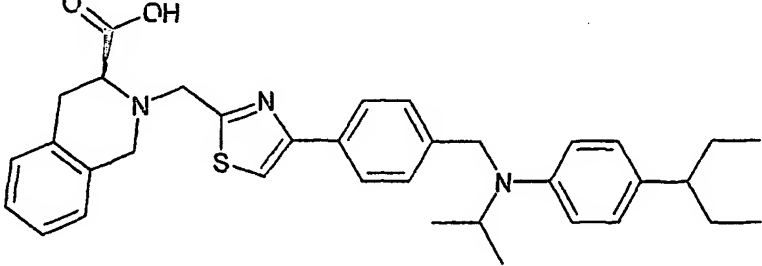
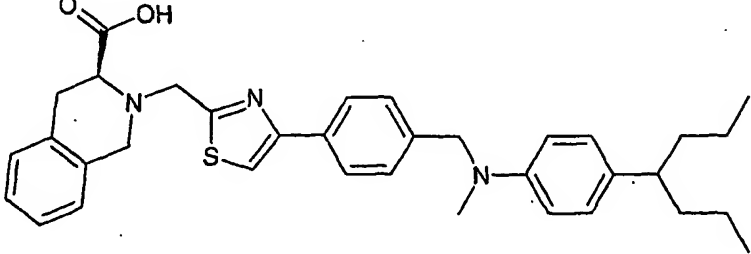
実施例	構造式	融点(°C)
1-31		168.5
1-32		127.5
1-33		アモルファス
1-34		アモルファス

表 1-10

实施例	構造式	融点(°C)
1-35		110 - 113
1-36		230 -
1-37		209 - 211
1-38		155 - 157
1-39		156 - 158

表 1-11

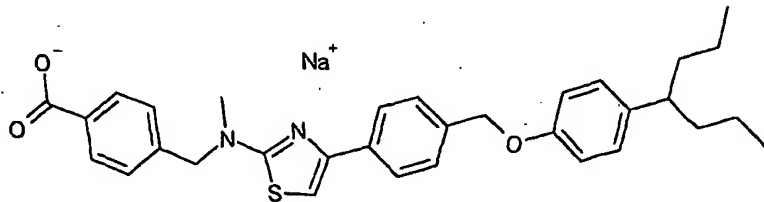
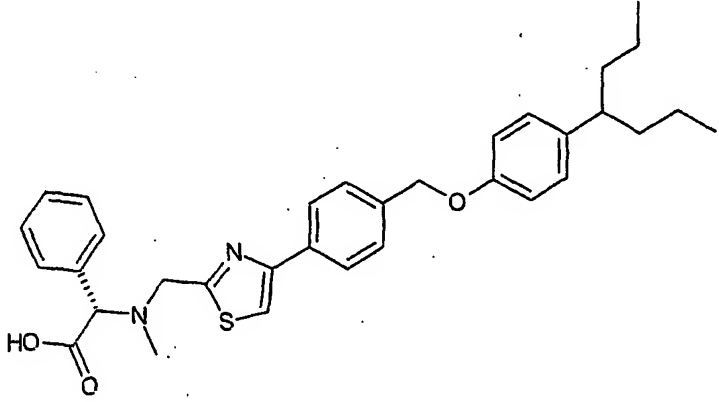
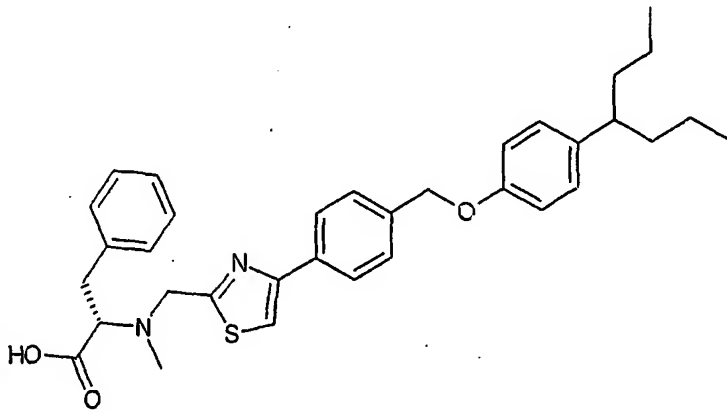
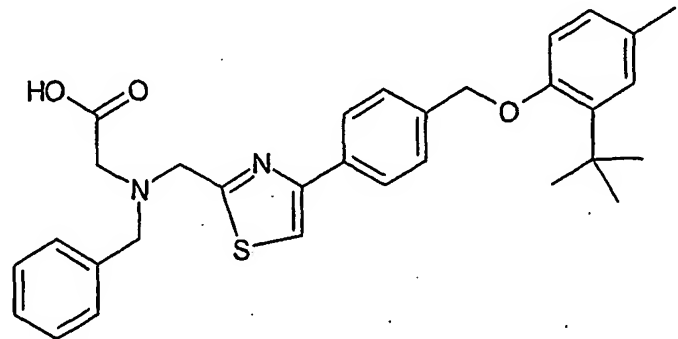
実施例	構造式	融点(°C)
1-40	 <chem>CCCC(C)(C)c1ccc(OCCc2ccc(cc2)-c3nc(CCN(C)Cc4ccc(cc4)C(=O)[O-])[nH]3)cc1.[Na+]</chem>	250 -
1-41	 <chem>CCCC(C)(C)c1ccc(OCCc2ccc(cc2)-c3nc(CCN(C)Cc4c(c(=O)O)cc5ccccc54)[nH]3)cc1</chem>	アモルファス
1-42	 <chem>CCCC(C)(C)c1ccc(OCCc2ccc(cc2)-c3nc(CCN(C)Cc4c(c(=O)O)cc5ccccc54)[nH]3)cc1</chem>	114 - 118
1-43	 <chem>CC(C)(C)c1ccc(OCCc2ccc(cc2)-c3nc(CCN(C)Cc4c(c(=O)O)cc5ccccc54)[nH]3)cc1</chem>	146

表 1-12

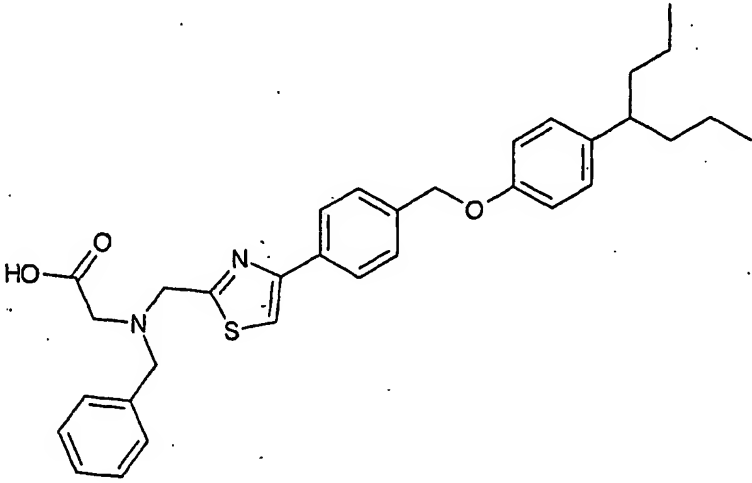
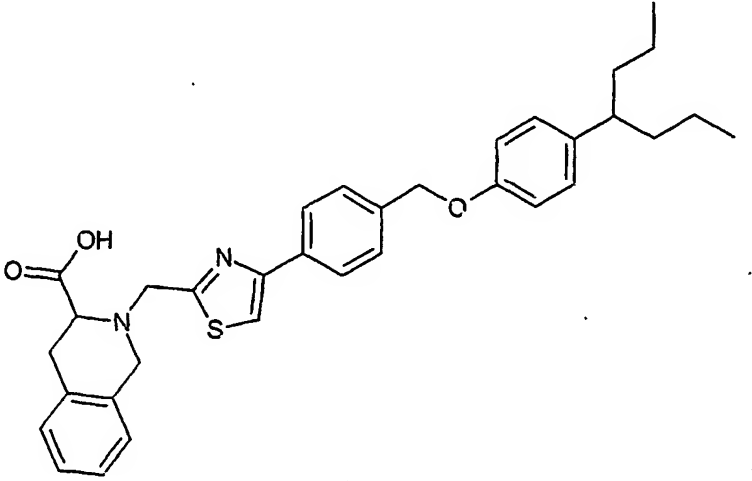
実施例	構造式	融点(°C)
1-44	 <chem>CCCC(C)Cc1ccc(OCCc2ccc(cc2)c3cc[nH]3CCN(Cc4ccccc4)CC(=O)O)c1</chem>	138 - 142
1-45	 <chem>CCCC(C)Cc1ccc(OCCc2ccc(cc2)c3cc[nH]3CCN4C(=O)O[C@H]5Cc6ccccc6CC[C@H]45)c1</chem>	117 - 126

表 1-13

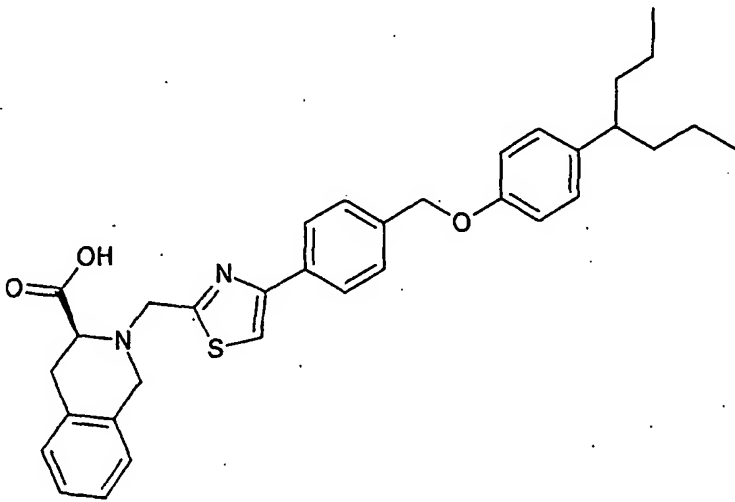
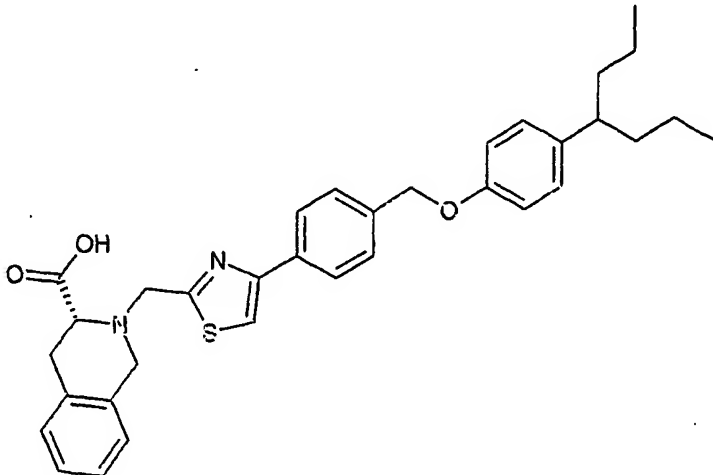
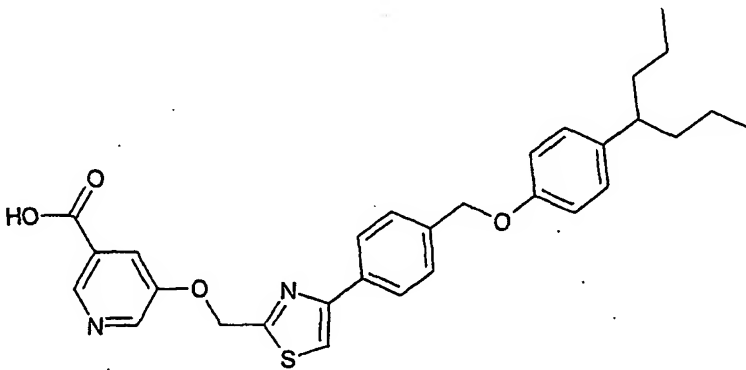
実施例	構造式	融点(°C)
1-46		77 - 82
1-47		77 - 82
1-48		165 - 171

表 1-14

実施例	構造式	融点(°C)
1-49		199 - 202
1-50		アモルファス
1-51		103.3 - 106.3
1-52		250 (分解)

表 1-15

実施例	構造式	融点(°C)
1-53	 <chem>CN(Cc1ccc(C(=O)O)cc1)c2nc(cc2-c3ccc(cc3)C(=O)Nc4ccc(cc4)C5CCCCC5)S</chem>	250 -
1-54	 <chem>OC(=O)CN(Cc1ccccc1)c2nc(cc2-c3ccc(cc3)C(=O)Nc4ccc(cc4)C5CCCC5)S</chem>	201 - 202
1-55	 <chem>OC(=O)CN(Cc1ccccc1)c2nc(cc2-c3ccc(cc3)C(=O)Nc4ccc(cc4)C5CCCC5)S</chem>	141 - 143

表 1-16

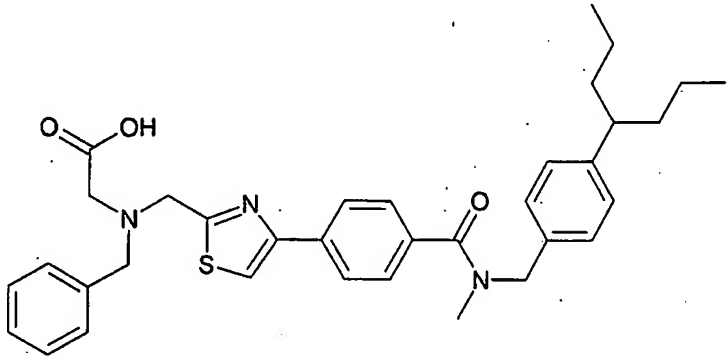
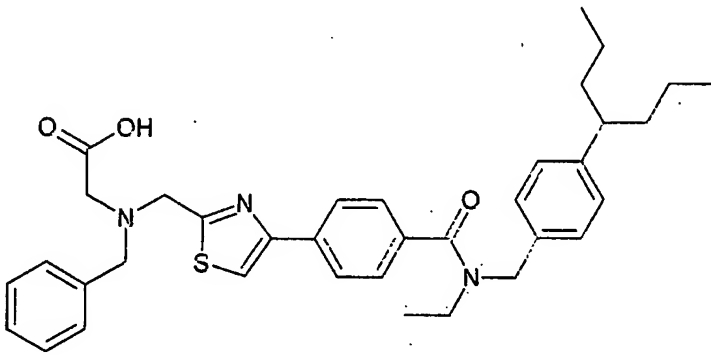
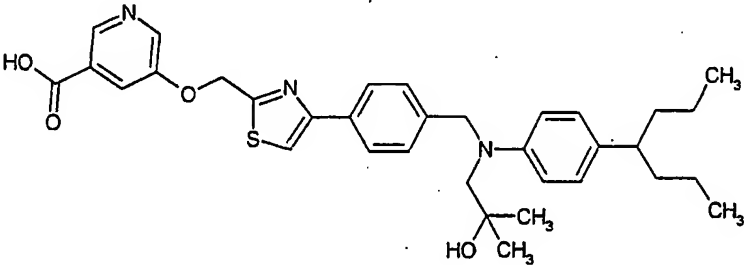
実施例	構造式	融点(°C)
1-56		65 - 71
1-57		59 - 65
1-58		アモルファス

表 1-17

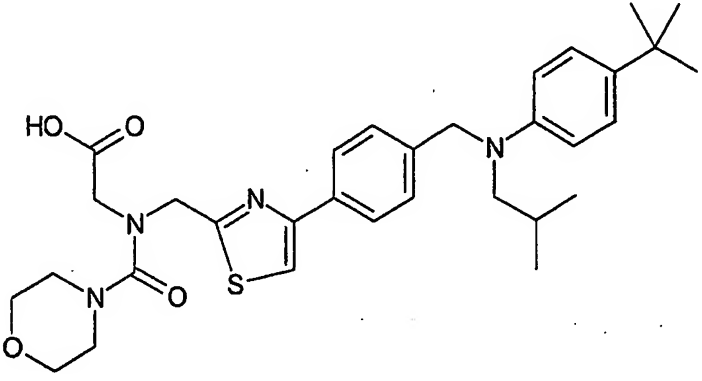
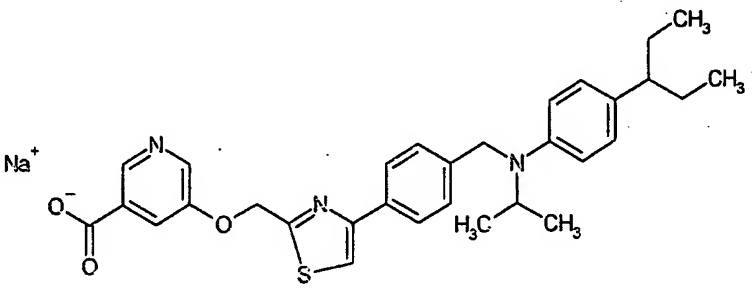
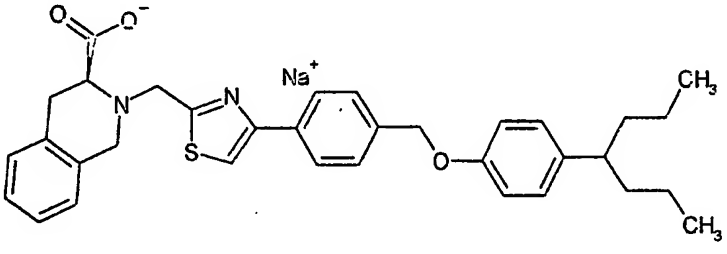
実施例	構造式	融点(°C)
1-59		138
1-60		70-77
1-61		250 -

表 1-18

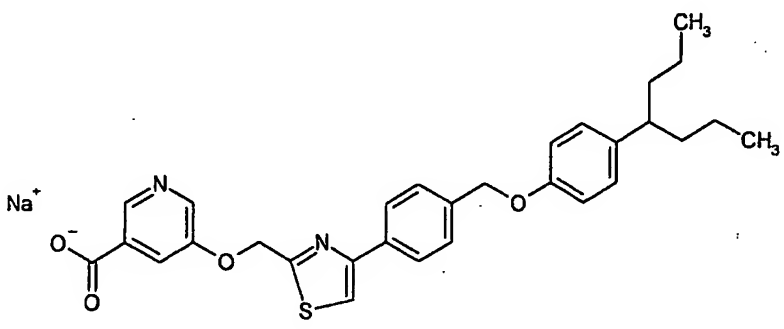
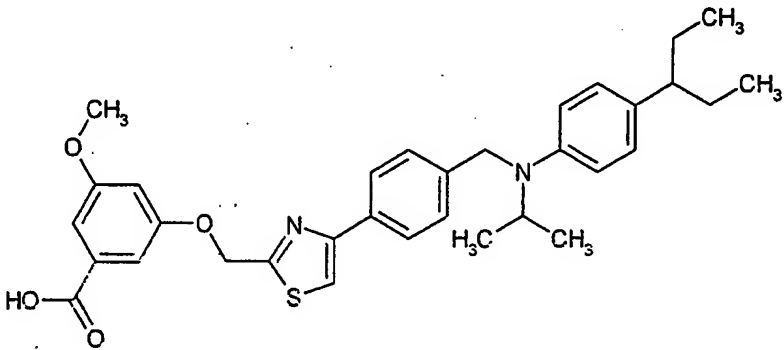
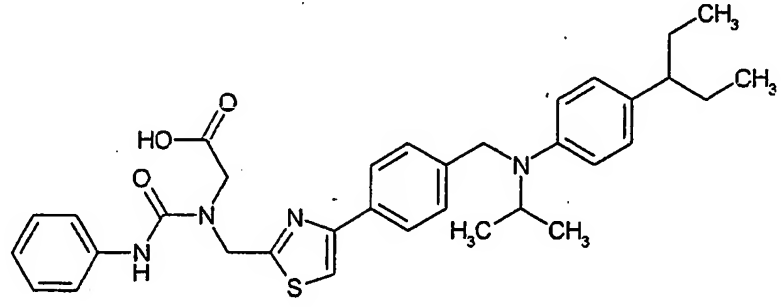
実施例	構造式	融点(°C)
1-62		250 -
1-63		131
1-64		アモルファス

表 1-19

実施例	構造式	融点(°C)
1-65		アモルファス
1-66		アモルファス
1-67		アモルファス
1-68		185 (分解)

表 1-20

実施例	構造式	融点(°C)
1-69		アモルファス
1-70		アモルファス
1-71		アモルファス
1-72		アモルファス

表 1-21

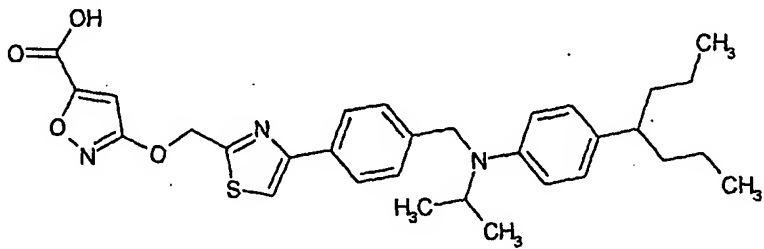
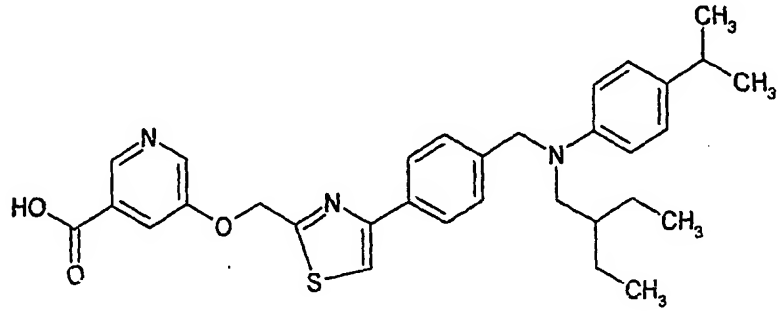
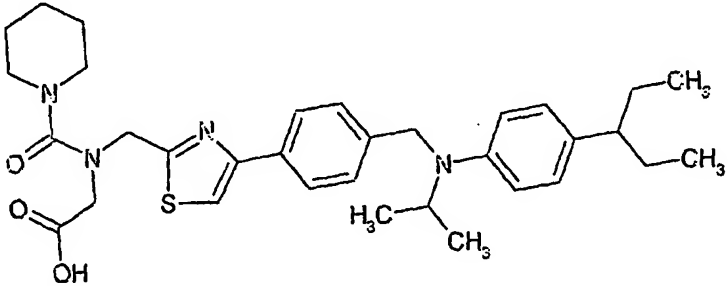
実施例	構造式	融点(°C)
1-73		アモルファス
1-74		181
1-75		アモルファス

表 1-22

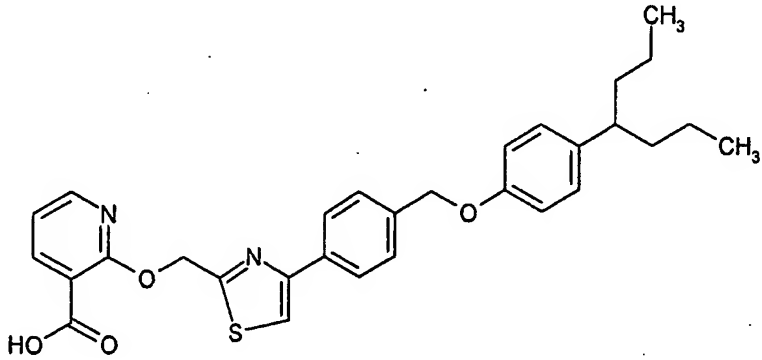
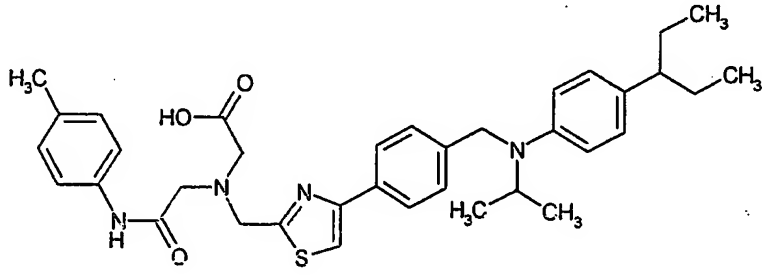
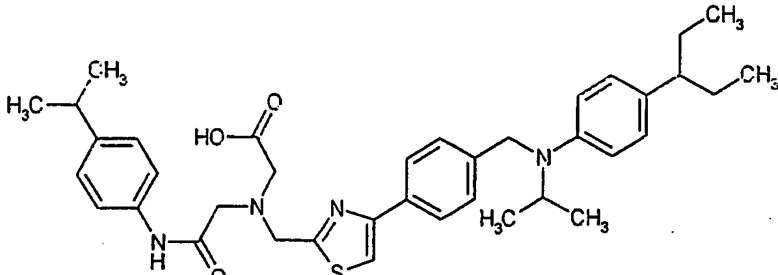
実施例	構造式	融点(°C)
1-76		154.5
1-77		アモルファス
1-78		アモルファス

表 1-23

実施例	構造式	融点(°C)
1-79		アモルファス
1-80		アモルファス
1-81		アモルファス
1-82		138.5 (分解)

表 1-24

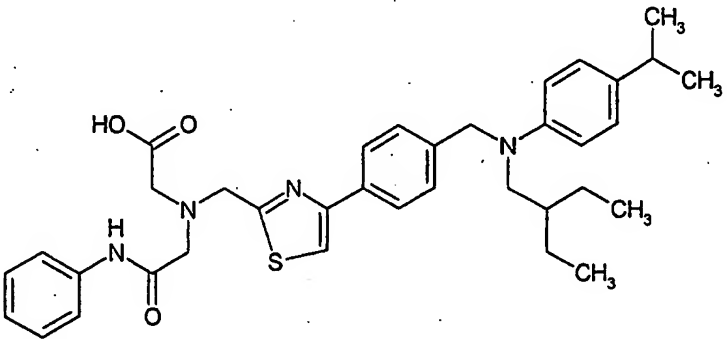
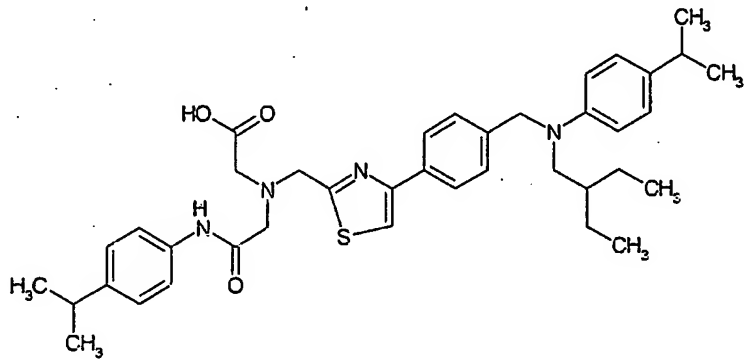
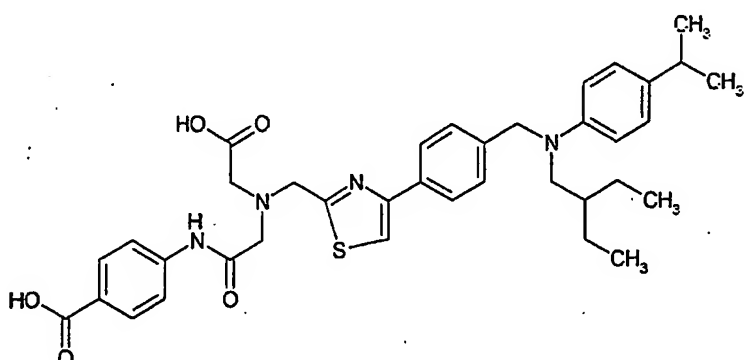
実施例	構造式	融点(°C)
1-83		アモルファス
1-84		アモルファス
1-85		アモルファス

表 1-25

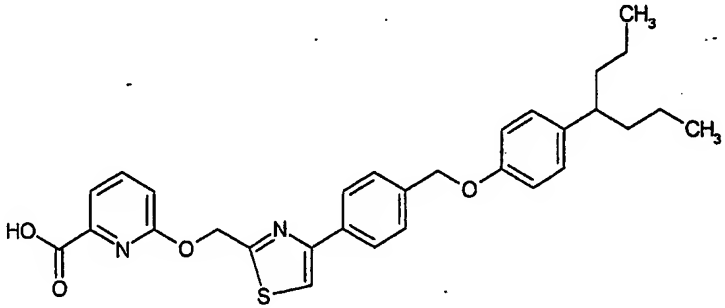
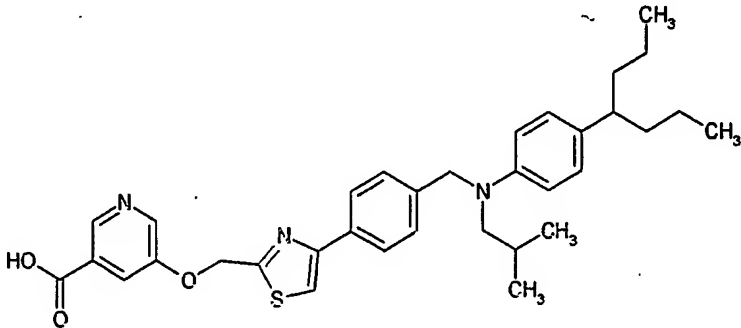
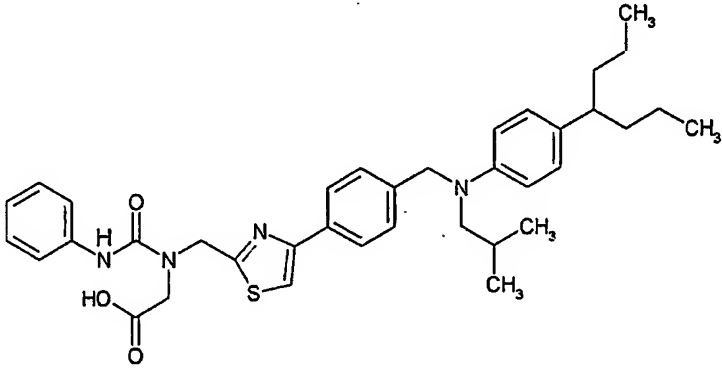
実施例	構造式	融点(°C)
1-86		アモルファス
1-87		アモルファス
1-88		アモルファス

表 1-26

実施例	構造式	融点(°C)
1-89		111 - 113
1-90		179 - 181
1-91		165 - 167
1-92		159 - 160

表 1-27

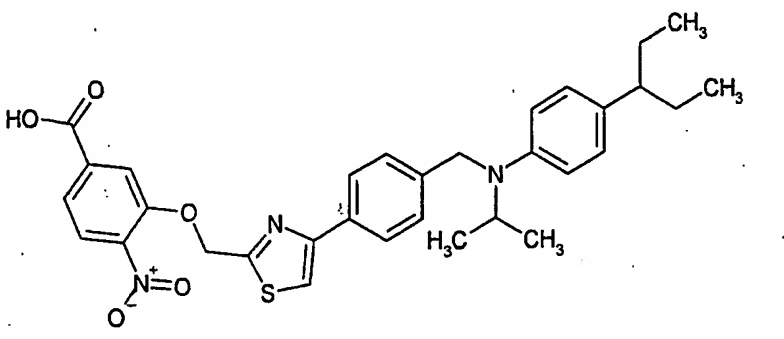
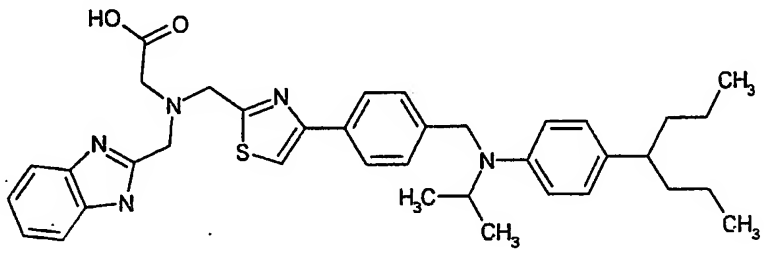
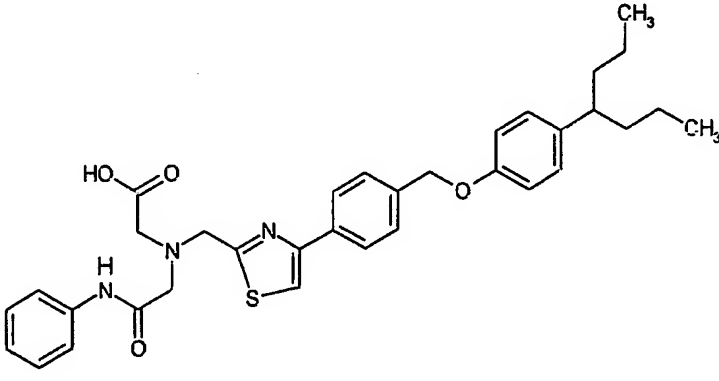
実施例	構造式	融点(°C)
1-93		198 - 200
1-94		アモルファス
1-95		149.5

表 1-28

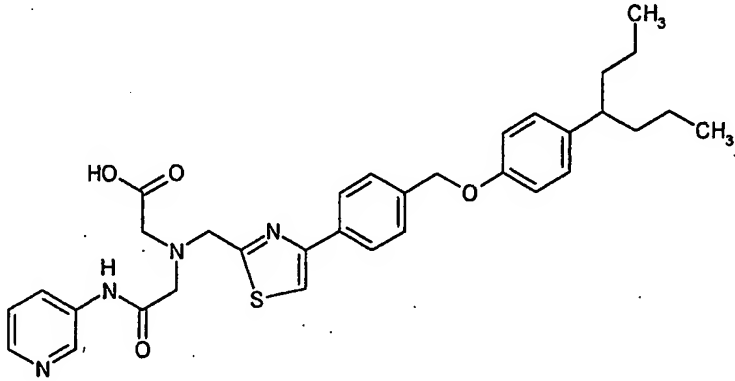
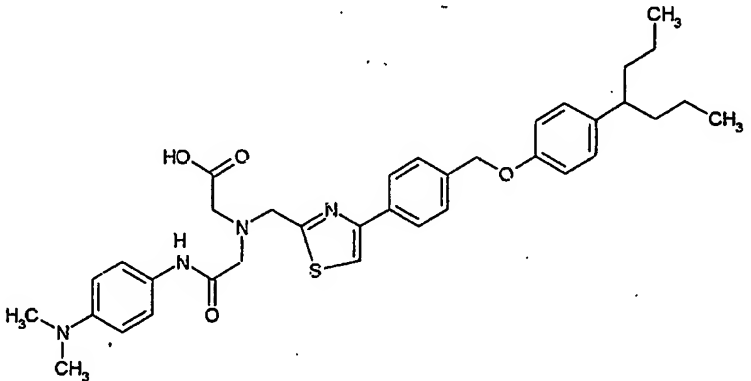
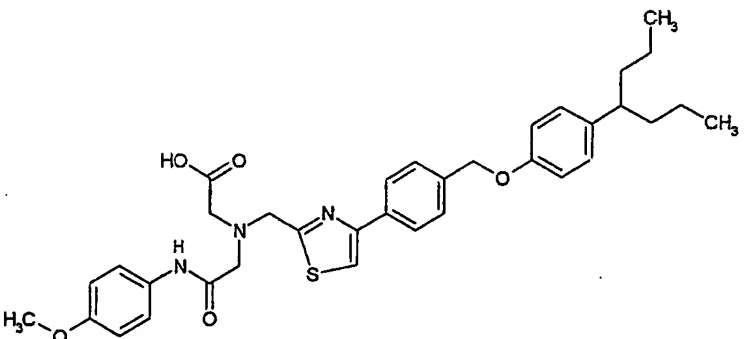
実施例	構造式	融点(°C)
1-96		162.5
1-97		192.5
1-98		176.5

表 1-29

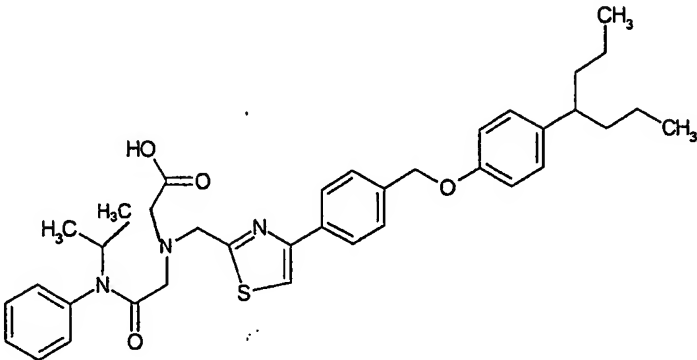
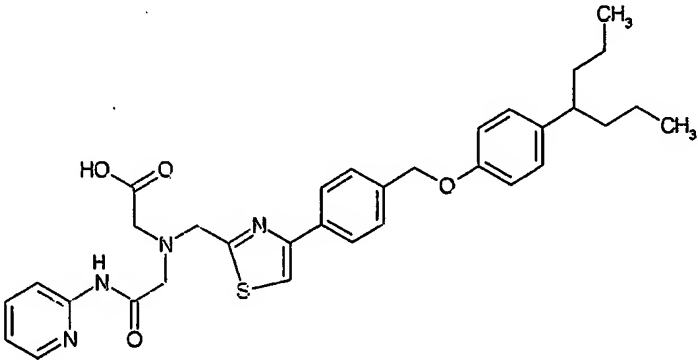
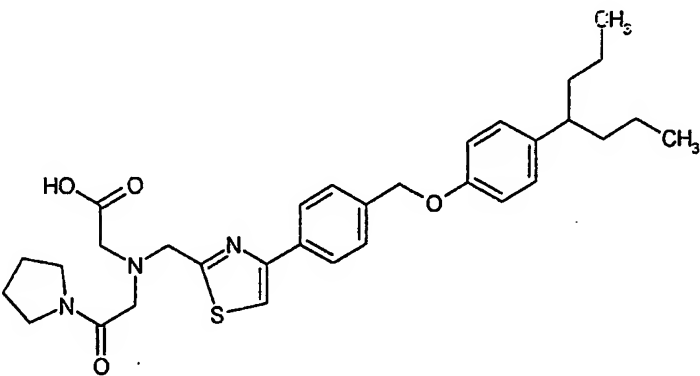
実施例	構造式	融点(°C)
1-99		115.5
1-100		133.5
1-101		アモルファス

表 1-30

実施例	構造式	融点(°C)
1-102		アモルファス
1-103		アモルファス
1-104		アモルファス
1-105		アモルファス

表 1-31

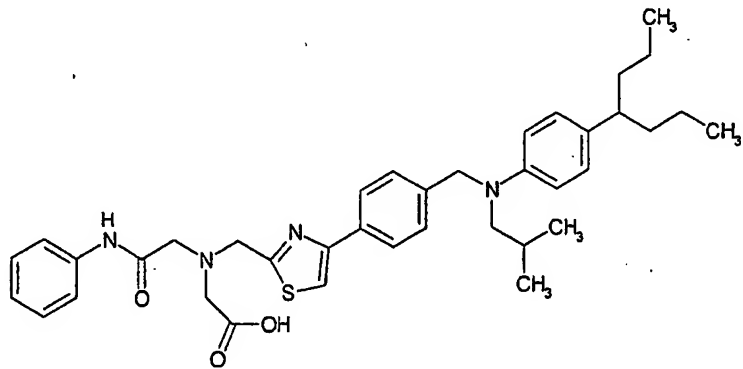
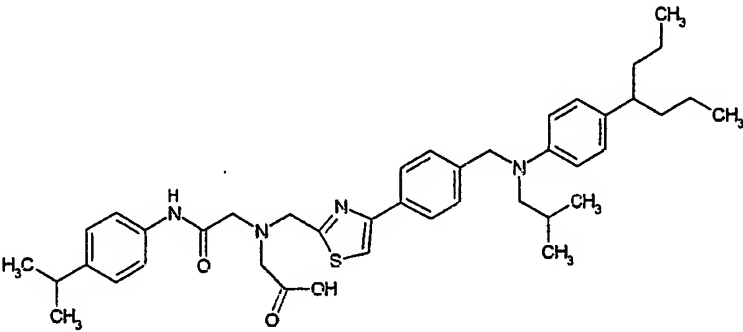
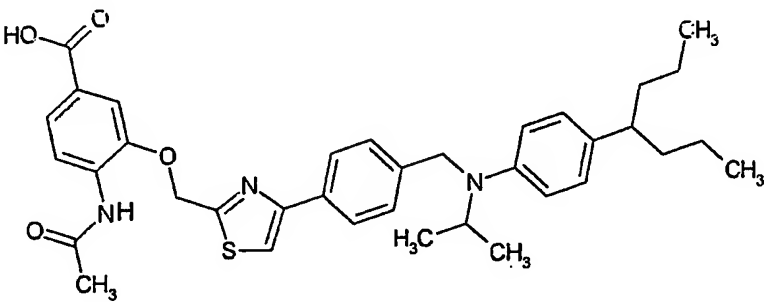
実施例	構造式	融点(°C)
1-106		アモルファス
1-107		アモルファス
1-108		129 - 131

表 1-32

実施例	構造式	融点(°C)
1-109		アモルファス
1-110		アモルファス
1-111		アモルファス
1-112		アモルファス

表 1-34

実施例	構造式	融点(°C)
1-116		146 - 148
1-117		アモルファス
1-118		アモルファス
1-119		アモルファス

表 1-35

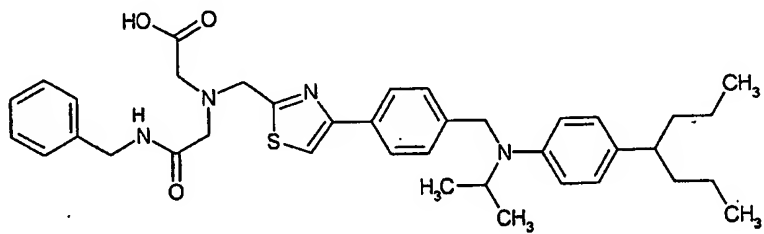
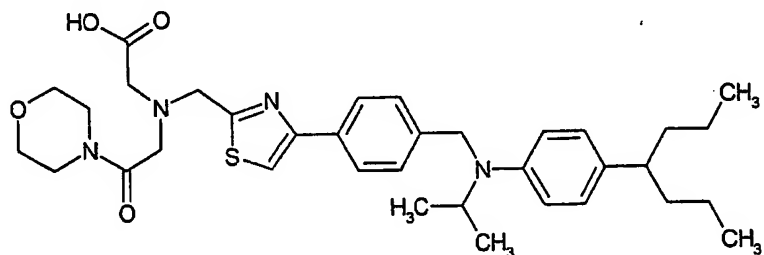
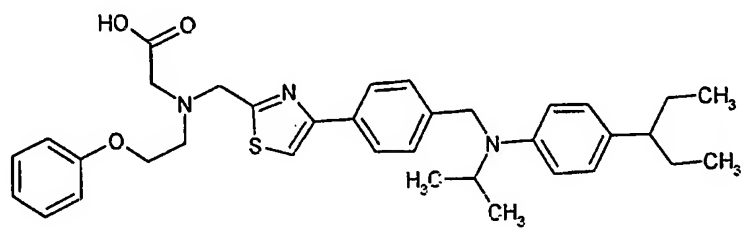
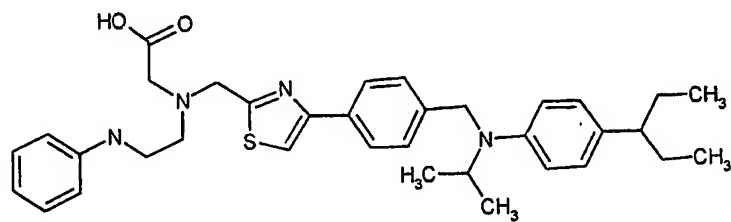
実施例	構造式	融点(°C)
1-120		アモルファス
1-121		アモルファス
1-122		アモルファス
1-123		アモルファス

表 1-36

実施例	構造式	融点(°C)
1-124		124
1-125		122
1-126		210 - 212

表 1-37

実施例	構造式	融点(°C)
1-127		アモルファス
1-128		アモルファス
1-129		143 - 145
1-130		170 - 172

表 1-38

実施例	構造式	融点(°C)
1-131		アモルファス
1-132		アモルファス
1-133		アモルファス
1-134		158 - 160

表 1-39

実施例	構造式	融点(°C)
1-135		192 - 194
1-136		アモルファス
1-137		アモルファス

表 1-40

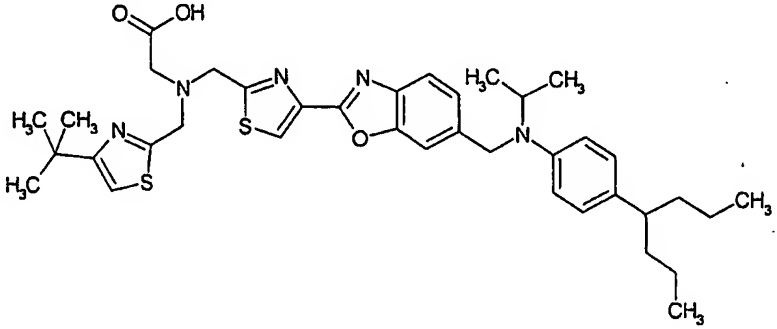
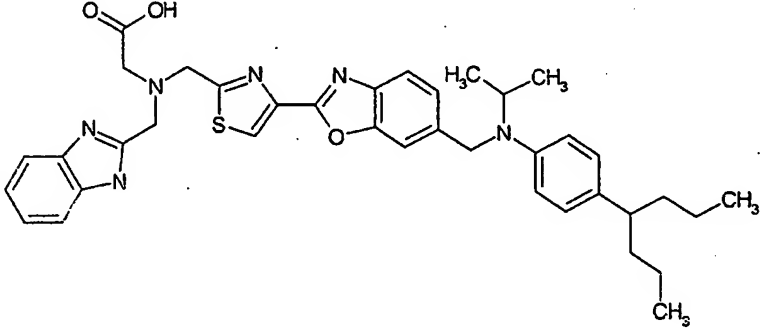
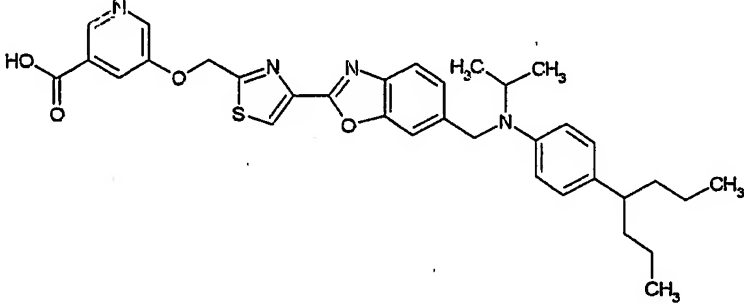
実施例	構造式	融点(°C)
1-138		98 - 100
1-139		127 - 133
1-140		135 - 138

表 1-42

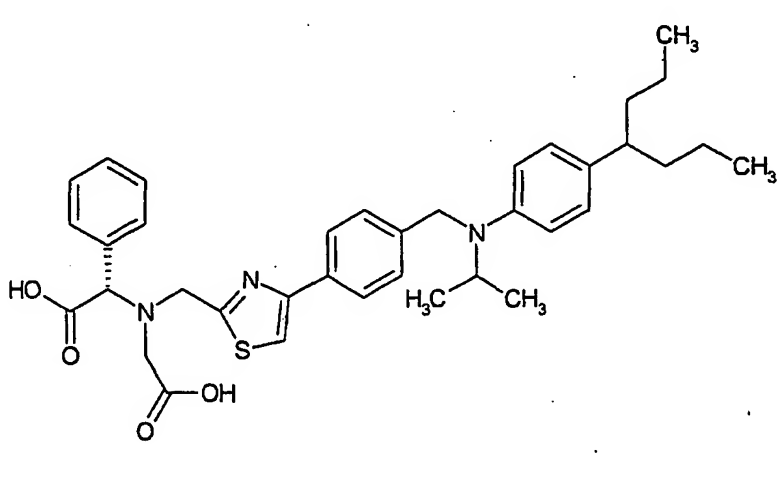
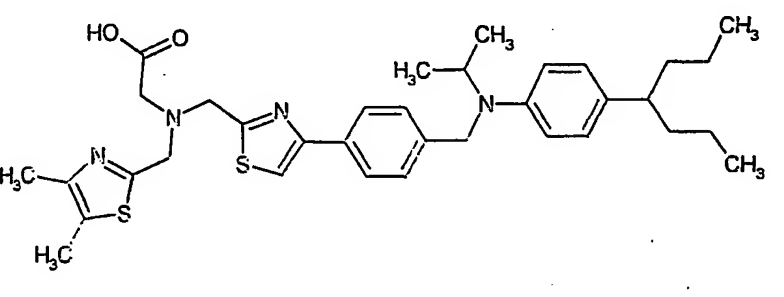
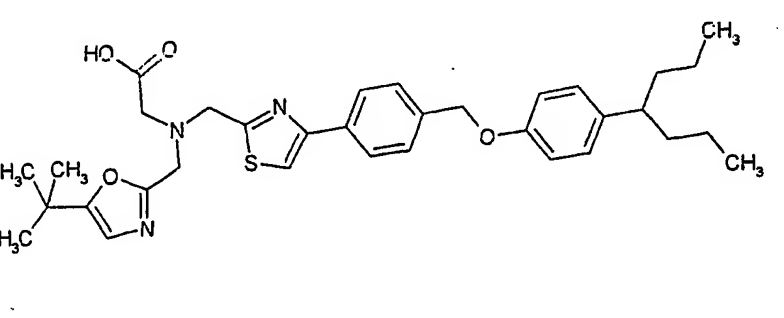
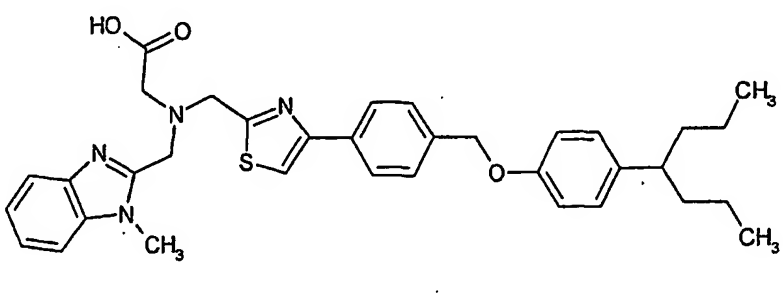
実施例	構造式	融点(°C)
1-145		アモルファス
1-146		156 - 157
1-147		アモルファス
1-148		アモルファス

表 1-43

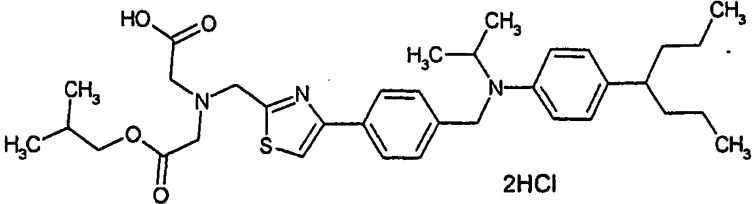
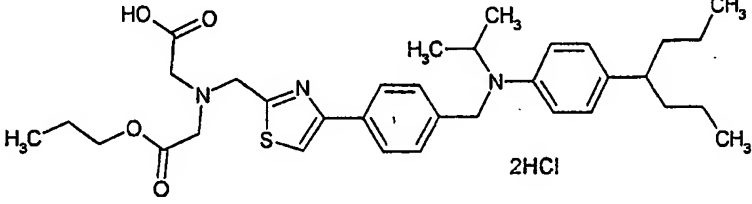
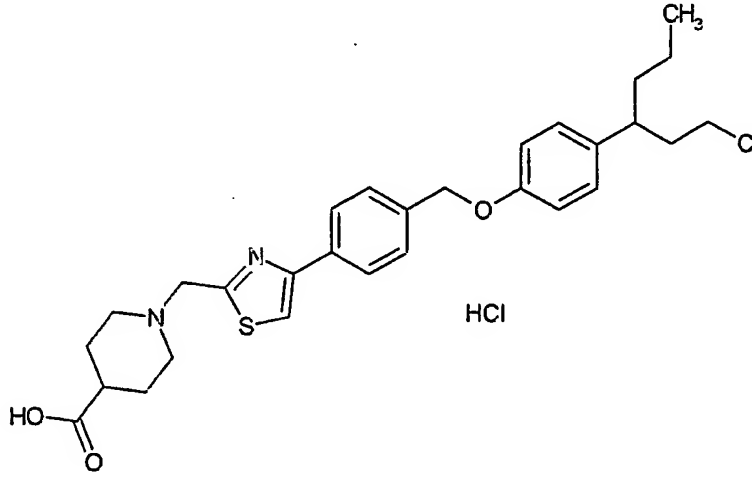
実施例	構造式	融点(°C)
1-149	 <p>2HCl</p>	アモルファス
1-150	 <p>2HCl</p>	アモルファス
1-151	 <p>HCl</p>	アモルファス

表 1-45

実施例	構造式	融点(°C)
1-154	<chem>CCCC(c1ccc(cc1)CN(C)Cc2ccc(cc2)-c3ccsc3CN4CCN(CC4)c5ccc(cc5)C(=O)O)C</chem>	232 - 234

表 1-46

実施例	構造式	融点(°C)
1-155		137 - 138
1-156		153 - 154
1-157		199 - 200

表 1-47

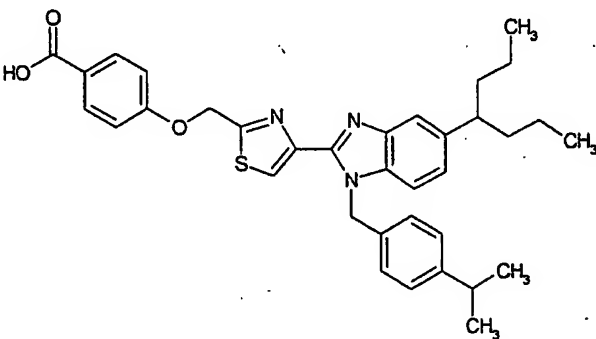
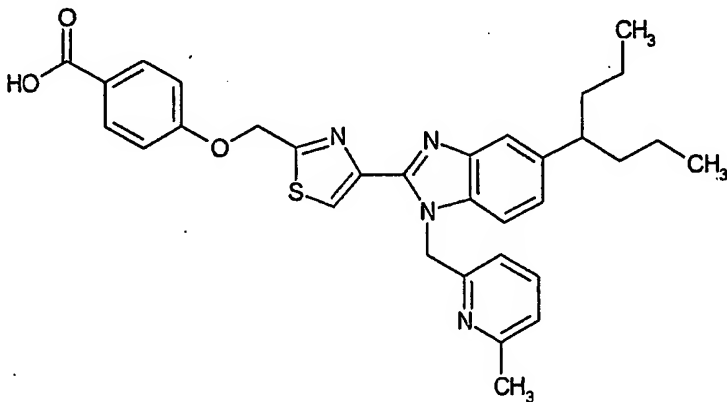
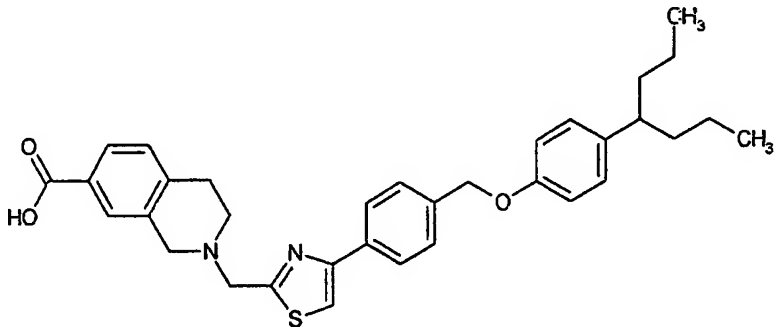
実施例	構造式	融点(°C)
1-158		147 - 152
1-159		113 - 116
1-160		148.5 - 149.5

表 1-48

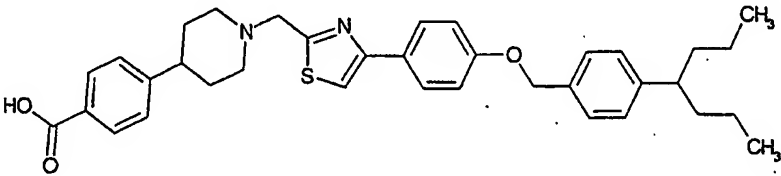
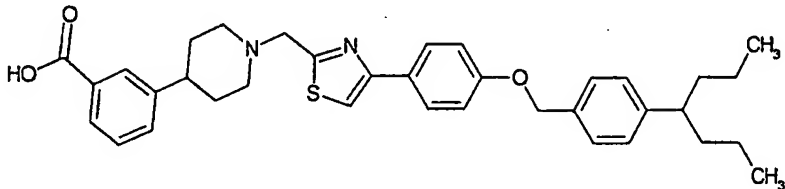
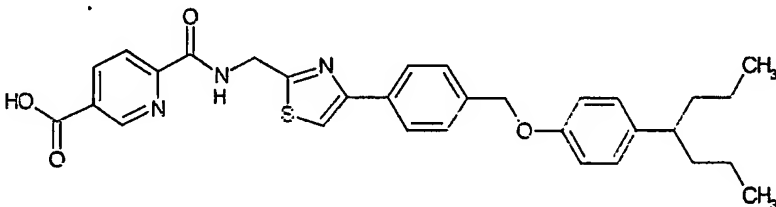
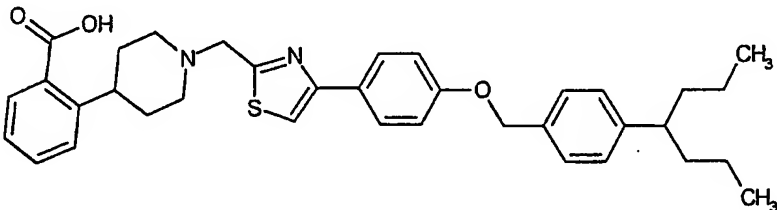
実施例	構造式	融点(°C)
1-161		191 - 193
1-162		187 - 189
1-163		164 - 166
1-164		170 - 172

表 1-49

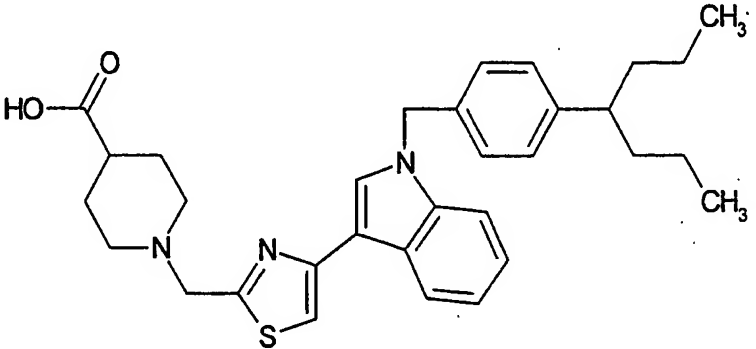
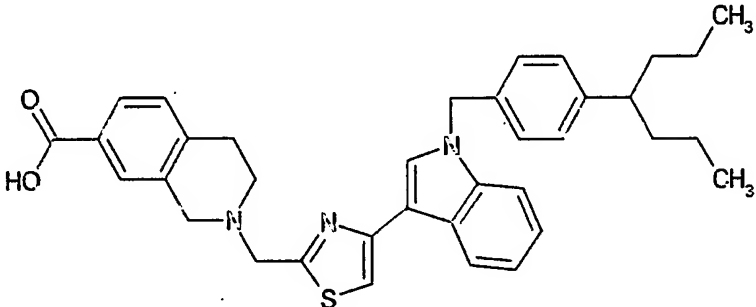
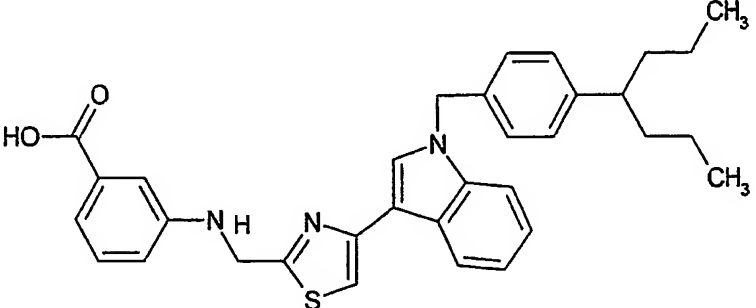
実施例	構造式	融点(°C)
1-165		111 - 115
1-166		124 - 128
1-167		83 - 85

表 1-50

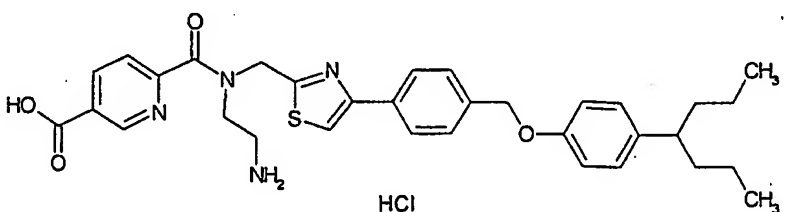
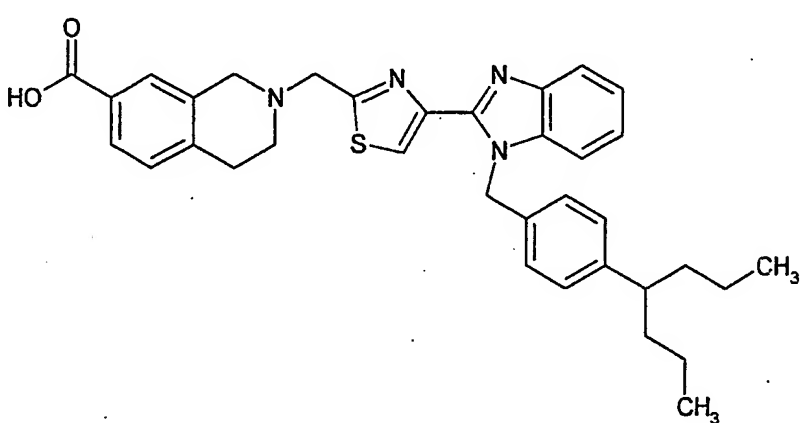
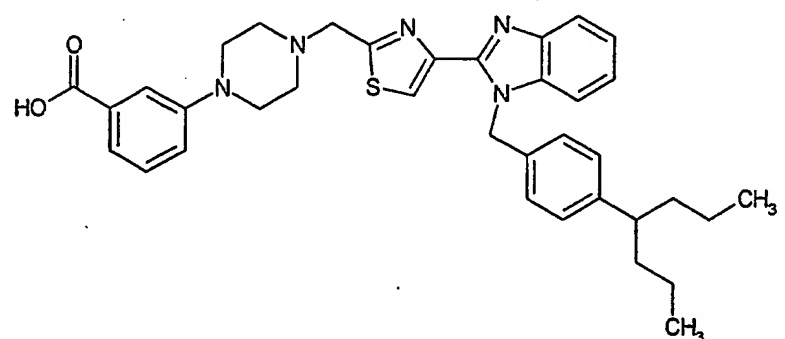
実施例	構造式	融点(°C)
1-168	 HCl	227 - 229
1-169		189.2 - 190.3
1-170		179.8 - 181.2

表 1-51

実施例	構造式	融点(°C)
1-171		208.5 - 209.8
1-172		107 - 110
1-173		197 - 199
1-174		222 - 228

表 1-52

実施例	構造式	融点(°C)
1-175		222 - 225
1-176		141 - 143
1-177		185 - 194
1-178		195 - 196.5

表 1-53

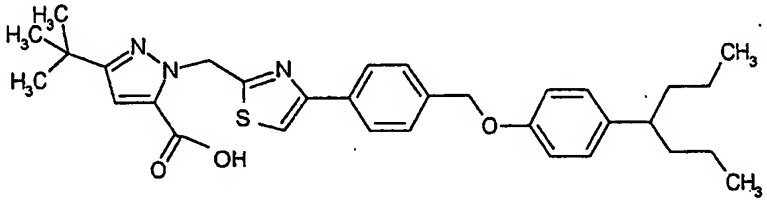
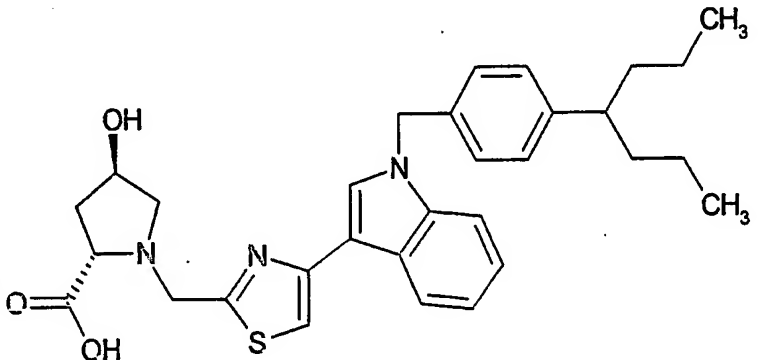
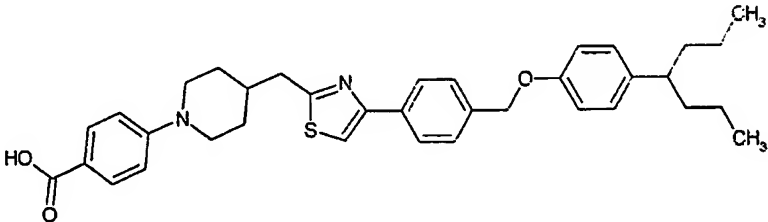
実施例	構造式	融点(°C)
1-179		123 - 125
1-180		105 - 107
1-181		174 - 175

表 1-54

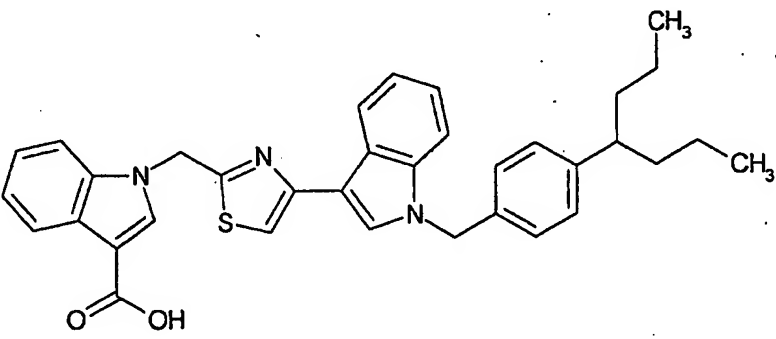
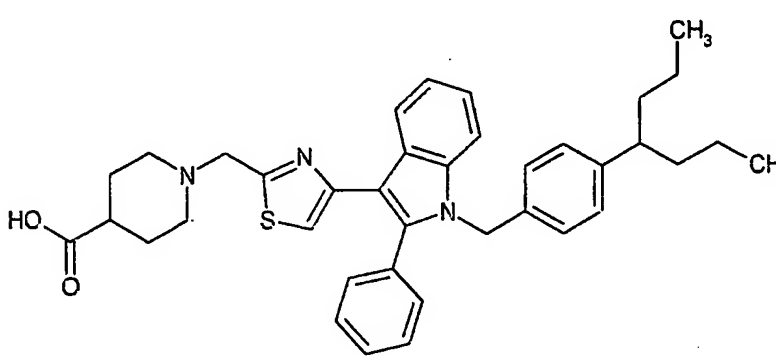
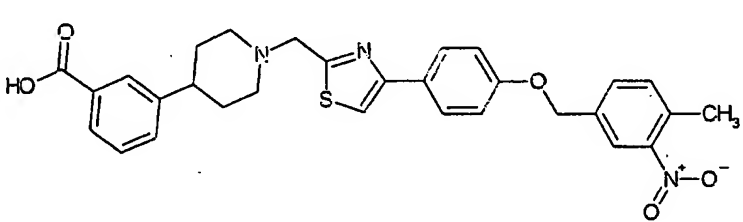
実施例	構造式	融点(°C)
1-182		148 - 152
1-183		101 - 103
1-184		205 - 210

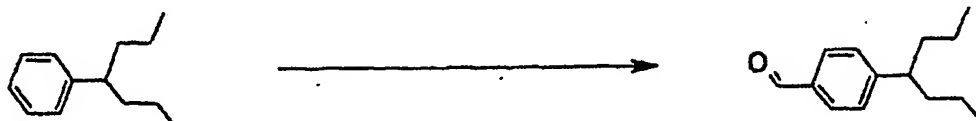
表 1-55

実施例	構造式	融点(°C)
1-185	 <chem>CC(C)c1ccc(cc1)CN2CCOCC2c3cc4nc5c(c3cc4)nc6c5cc(C(=O)O)ccc6N7CCN(CCN7C8=CC=CC=C8C8=CC=CC=C8C8=CC=CC=C8C8=CC=CC=C8)CC8</chem>	141 - 143.2
1-186	 <chem>CC(C)c1ccc(cc1)CN2CCOCC2c3cc4nc5c(c3cc4)nc6c5cc(C(=O)O)ccc6N7CCN(CCN7C8=CC=CC=C8C8=CC=CC=C8C8=CC=CC=C8C8=CC=CC=C8)CC8</chem>	128.5 - 131.5

実施例 2-1

{ベンジル-[4-(4-{メチル-[4-(1-プロピルブチル)ベンジル]アミノ}-フェニル)-オキサゾール-2-イルメチル]-アミノ}-酢酸

5 (1) 4-(1-プロピルブチル)ベンズアルデヒド



四塩化チタン (18.7 ml, 170 mmol) のクロロホルム (50 ml) 溶液に、氷冷下、(1-プロピルブチル)ベンゼン (10.0 g, 56.7 mmol) とジクロロメチルメチルエーテル (7.70 ml, 85.1 mmol) のクロロホルム (40 ml) 溶液を滴下し、同温度

10 下で1時間攪拌した。反応液を氷 (100 g) に注ぎ、室温で1時間攪拌した。有機層を水、0.5 N水酸化ナトリウム水溶液、水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。ろ過、除媒後、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出液; 酢酸エチル-ヘキサン 1 :

15 50) にて精製し標題化合物 (10.0 g, 収率 37%) を得た。

(2) N-メチル-4-(1-プロピルブチル)ベンジルアミン塩酸塩



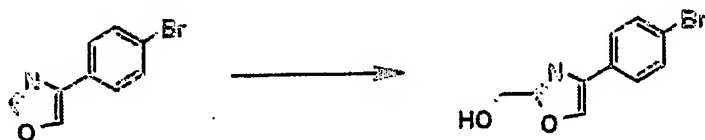
実施例 2-1 (1) で得られた 4-(1-プロピルブチル)ベンズアルデヒド (1.00 g, 4.89 mmol) のエタノール溶液に、氷冷

20 下、メチルアミンのメタノール溶液 (2 mol/l, 2.94 ml) を加え、室温で30分間攪拌した。除媒後、テトラヒドロフラン (10 ml) に溶解し、氷冷下、水素化ホウ素ナトリウム (28.5 mg, 7.5

3 mmol) を加え、室温にて 1 時間攪拌した。エタノールを加え 6 時間攪拌後、除媒し、クロロホルム (10 ml) を加え、氷冷下、水、2 N-塩酸を加えて、室温にて 3 時間攪拌した。有機層に、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、ジ-tert-ブチルジカーボネート (1.28 g, 5.87 mmol) を加え、3 時間攪拌した。有機層を、飽和食塩水で洗淨し、硫酸ナトリウムで乾燥した。除媒後、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出液; 酢酸エチル-ヘキサン 5:95) にて精製し油状物を得た。

得られた油状物を、酢酸エチル (2 ml) に溶解し、4 N-塩化水素酢酸エチル溶液 (10 ml) を加え、3 時間攪拌した。ヘキサン (10 ml) を加え、析出物を、ろ取、乾燥して、標題の化合物 (650 mg, 収率 52%) を得た。

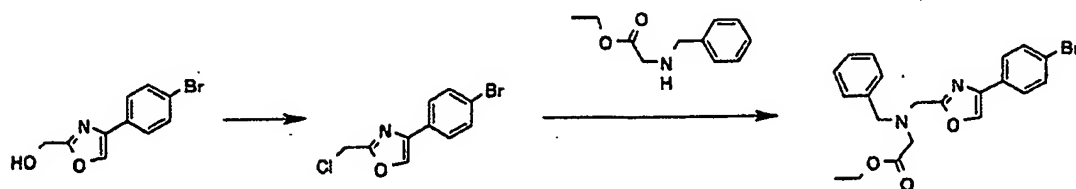
(3) (4-(4-ブロモフェニル)オキサゾール-2-イル)メタノール



15

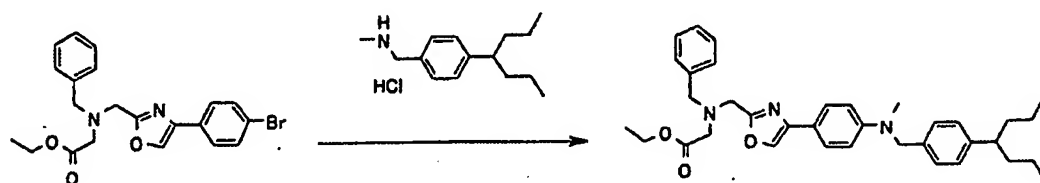
アルゴン雰囲気下、2, 2, 6, 6-テトラメチルピペリジン (227 mg, 1.61 mmol) のテトラヒドロフラン (3.0 ml, 13 v/w) 溶液に、0℃にてn-ブチルリチウム (1.56 Mヘキサン溶液, 0.944 ml, 1.47 mmol) を加え、30 分間攪拌した。-78℃に冷却後、4-(4-ブロモフェニル)オキサゾール (300 mg, 1.34 mmol) を加え、45 分間攪拌した。パラホルムアルデヒド (100 mg, 3.35 mmol) のテトラヒドロフラン (1.5 ml, 15 v/w) 懸濁液を加え、20 分間攪拌した。室温に昇温後、飽和塩化アンモニウム水溶液 (5.0 ml) を加えた。除媒後、酢酸エチル (15 ml) で抽出し、飽和食塩水 (10 ml) で洗淨し、硫酸ナトリウム (1.0 g) で乾燥した。除媒後、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒 クロロホルム~クロロホルム: 酢酸エチル=8:2) にて精製し、標題化合物 (210 mg, 収率 62%) を得た。

(4) N-ベンジル-N-((4-(4-ブロモフェニル)オキサゾール-2-イル)メチル)グリシン エチルエステル



アルゴン雰囲気下、実施例 2-1 (3) で得られた (4-(4-プロ
モフェニル)オキサゾール-2-イル)メタノール (200 mg, 0.
787 mmol) のクロホルム (4.0 ml, 20 v/w) 懸濁液に、
0℃にて、塩化チオニル (103 mg, 0.866 mmol) を加えた。
室温にて1時間攪拌後、60℃にて1時間攪拌した。室温にて、塩化チ
オニル (103 mg, 0.866 mmol) を加え、12時間攪拌した。
10 除媒後、アセトニトリル (2.0 ml)、N-ベンジルグリシン エチル
エステル (0.221 ml, 1.18 mmol)、炭酸カリウム (326
mg, 2.36 mmol)、ヨウ化カリウム (13 mg, 0.0787 m
mol) を順次加えた。60℃にて、1時間攪拌した。室温にて、蒸留
水 (5.0 ml) を加え、ヘキサン：酢酸エチル=1：1 混合溶媒にて
15 抽出し、飽和食塩水 (5.0 ml) で洗浄し、硫酸ナトリウム (1.0
g) で乾燥した。除媒後、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開
溶媒 ヘキサン：酢酸エチル=9：1) にて精製し、標題化合物 (22
0 mg, 収率 65%) を得た。

(5) {ベンジル-[4-(4-{メチル-[4-(1-プロピル-ブチ
20 ル)ベンジル]アミノ}-フェニル)-オキサゾール-2-イル)メチ
ル]-アミノ}-酢酸 エチルエステル



アルゴン雰囲気下、実施例 2-1 (4) で得られた N-ベンジル-N-
-((4-(4-プロモフェニル)オキサゾール-2-イル)メチル)グ

リシン エチルエステル (200 mg, 0.466 mmol) のジオキサン (2.0 ml) 溶液に、実施例 2-1 (2) で得られた N-メチル-4-(1-プロピルブチル) ベンジルアミン・塩酸塩 (13.1 mg, 0.512 mmol)、(R)-(+)-2, 2'-ビス (ジフェニルホスフィノ) -1, 1'-ビナフチル (29.0 mg, 0.0466 mmol)、炭酸セシウム (334 mg, 1.03 mmol)、酢酸パラジウム (5.20 mg, 0.0233 mmol) を順次加えた。90℃にて、18時間攪拌した後、(R)-(+)-2, 2'-ビス (ジフェニルホスフィノ) -1, 1'-ビナフチル (70.0 mg, 0.112 mmol)、酢酸パラジウム (10.0 mg, 0.0445 mmol) を加えた。10 00℃にて、3時間攪拌後、炭酸セシウム (200 mg, 0.614 mmol) を加え、12時間攪拌した。4-モルホリノアニリン (83.0 mg, 0.466 mmol) を加え、4時間攪拌後、室温にて、セライト濾過した。除媒後、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒 ヘキサン: 酢酸エチル = 9:1) にて精製し、標題化合物 (35.0 mg, 収率 13%) を得た。

(6) {ベンジル-[4-(4-{メチル-[4-(1-プロピルブチル) ベンジル] アミノ}-フェニル)-オキサゾール-2-イルメチル]-アミノ}-酢酸



20

アルゴン雰囲気下、実施例 2-1 (5) で得られた {ベンジル-[4-(4-{メチル-[4-(1-プロピルブチル) ベンジル] アミノ}-フェニル)-オキサゾール-2-イルメチル]-アミノ}-酢酸エチルエステル (30.0 mg, 0.0528 mmol) のテトラヒドロフラン (0.50 ml) 溶液に、メタノール (0.50 ml)、2N水酸化ナトリウム水溶液 (0.0528 ml, 0.106 mmol) を加えた。70℃にて、1.5時間攪拌後、室温にて、1N塩酸 (0.106 ml, 0.106 mmol)、蒸留水 (2.0 ml) を順次加えた。除

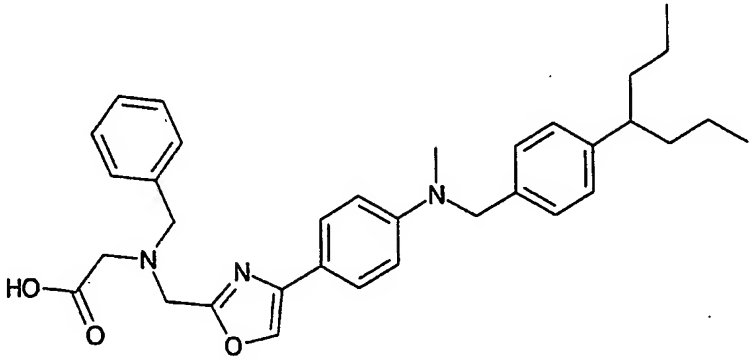
媒後、ヘキサン（0.2 ml）、蒸留水（2.0 ml）を順次加えた。析出物を濾取し、乾燥して、標題化合物（16.0 mg，収率56%）を得た。

¹HNMR(DMSO-d₆, 300MHz) δ 0.79 (t, J = 7.3 Hz, 6 H), 0.95- 1.20 (m, 4
5 H), 1.40- 1.65 (m, 4 H), 2.40- 2.60 (m, 1 H), 3.02 (s, 3 H), 3.81 (s, 2 H), 3.93 (s, 2 H), 4.57 (s, 2 H), 6.78 (d, J = 8.8 Hz, 2 H), 7.00- 7.40 (m, 9 H), 7.55 (d, J = 8.8 Hz, 2 H), 8.30 (s, 1 H), 12.30 (br s, 1 H).

融点 129℃-131℃

10 実施例2-1の構造式及び物性値を以下の表に示した。

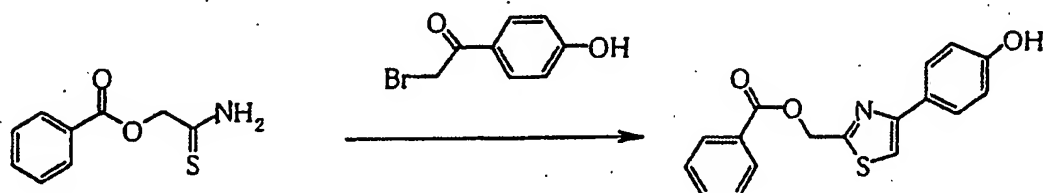
表 2

実施例	構造式	融点(°C)
2-1		129 - 131

実施例 3-1

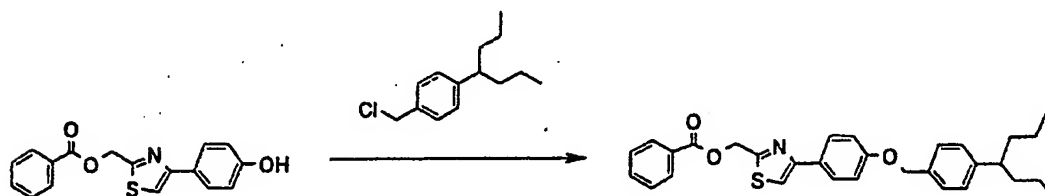
5- (4- {4- [4- (1-プロピルブチル) -ベンジルオキシ] -フェニル} -チアゾール-2-イルメトキシ) -ニコチン酸

(1) (4- (4-ヒドロキシフェニル) チアゾール-2-イル) メチル
5 ベンゾエート



2- (ベンゾイルオキシ) エタンチオアミド (4 g, 20.488 mmol)、炭酸水素ナトリウム (1.72 g, 20.488 mmol) の N, N-ジメチルアセトアミド (4 ml) 溶液に、室温下 2-ブromo-4'-ヒドロキシアセトフェノン (5 g、純度 88%、20.488 mmol) の N, N-ジメチルアセトアミド (8 ml) 溶液を滴下し、同温で 2 時間攪拌した。反応終了後、エタノール、水を加え析出物をろ取し、50% エタノールで洗浄した。得られた固体を減圧下乾燥し標題化合物 (5.336 g、84.1%) を得た。

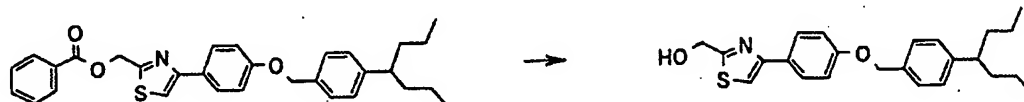
15 (2) (4- (4- (4- (1-プロピルブチル) ベンジルオキシ) フェニル) チアゾール-2-イル) メチル ベンゾエート



実施例 3-1 (1) で得られた (4- (4-ヒドロキシフェニル) チアゾール-2-イル) メチル ベンゾエート (14.0 g, 44.9 mmol) の N, N-ジメチルアセトアミド (70 ml) 溶液に、4- (1-プロピルブチル) ベンジルクロライド (10.1 g, 44.9 mmol)、炭酸カリウム (12.4 g, 89.9 mmol)、ヨウ化カリウム (75 mg, 0.45 mmol) を加え、80℃で 3 時間攪拌した。放

冷後、酢酸エチルを加え、水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。ろ過、除媒後、エタノール（120 ml）を加え、50℃に加熱した。放冷後、析出した結晶をろ取、乾燥して標題化合物（19.5 g, 収率87%）を得た。

- 5 (3) (4-(4-(4-(1-プロピルブチル)ベンジルオキシ)フェニル)チアゾール-2-イル)メタノール



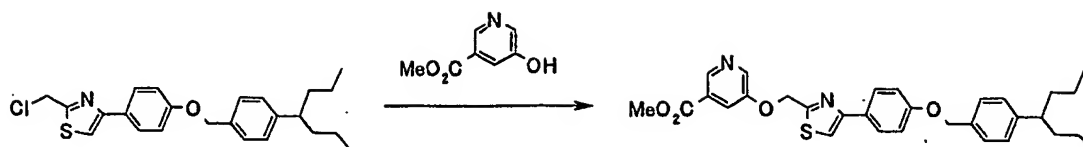
- 実施例3-1(2)で得られた(4-(4-(4-(1-プロピルブチル)ベンジルオキシ)フェニル)チアゾール-2-イル)メチルベン
 10 ゾエート(26.5 g, 53.1 mmol)にメタノール(159 ml)、
 テトラヒドロフラン(27 ml)、2N-水酸化ナトリウム水溶液(39.8 ml, 79.6 mmol)を加え、80℃で1時間攪拌した。除媒後、
 水(265 ml)を加え室温で1時間攪拌した。結晶をろ取後、トルエ
 ン(100 ml)、酢酸エチル(10 ml)に溶解し、飽和食塩水で洗浄
 15 した。硫酸マグネシウムで乾燥し、ろ過、除媒して標題化合物(20.5 g, 収率98%)を得た。

- (4)-(4-(4-(4-(1-プロピルブチル)ベンジルオキシ)フェ
 ニル)チアゾール-2-イル)メチルクロライド

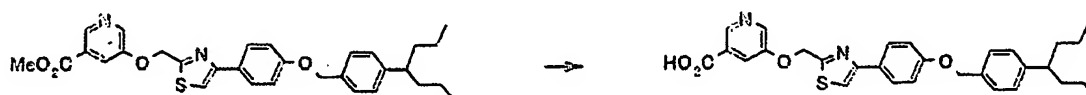


- 20 実施例3-1(3)で得られた(4-(4-(4-(1-プロピルブ
 チル)ベンジルオキシ)フェニル)チアゾール-2-イル)メタノール
 (20.5 g, 51.8 mmol)のクロロホルム(103 ml)溶液
 に、塩化チオニル(9.17 g, 77.7 mmol)を加え、室温で1
 時間攪拌した。除媒後、標題化合物(21.9 g, 定量的)を得た。
 25 (5) 5-(4-{4-[4-(1-プロピルブチル)-ベンジルオ
 キシ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメトキシ)-ニコチン酸

メチルエステル



- 実施例 3-1 (4) で得られた (4- (4- (4- (1-プロピルブチル) ベンジルオキシ) フェニル) チアゾール-2-イル) メチルクロライド (13.0 g, 31.4 mmol) に N, N-ジメチルアセトアミド (104 ml)、5-ヒドロキシニコチン酸メチル (5.25 g, 40.8 mmol)、炭酸カリウム (13.0 g, 94.2 mmol)、ヨウ化カリウム (520 mg, 3.1 mmol) を加え、75℃で2時間
- 10 攪拌した。放冷後、酢酸エチルを加え、水、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、水、飽和食塩水で順次洗浄した。硫酸マグネシウムで乾燥し、ろ過、除媒後、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出液: トルエン-酢酸エチル 5:1) にて精製した。得られた粗結晶をエーテルでスラリー洗浄して標題化合物 (9.91 g, 収率59%) を得た。
- 15 (6) 5- (4- {4- [4- (1-プロピルブチル) -ベンジルオキシ] -フェニル} -チアゾール-2-イルメトキシ) -ニコチン酸



- 実施例 3-1 (5) で得られた 5- (4- {4- [4- (1-プロピルブチル) -ベンジルオキシ] -フェニル} -チアゾール-2-イルメトキシ) -ニコチン酸 メチルエステル (9.50 g, 17.9 mmol) にテトラヒドロフラン (62.5 ml)、エタノール (62.5 ml)、2N-水酸化ナトリウム水溶液 (17.9 ml, 35.8 mmol) を加え、70℃で2時間30分攪拌した。氷冷下、2N-塩酸 (17.9 ml, 35.8 mmol) を加え、減圧濃縮した。エタノール (19
- 25 ml)、水 (9.5 ml) を加え、攪拌後、結晶をろ取、乾燥して、標題化合物 (9.15 g, 収率99%) を得た。

¹HNMR (DMSO-d₆, 400MHz) δ 0.81 (t, J=7.3Hz, 6H), 1.05-1.13 (m, 4H),

1.48-1.57 (m, 4H), 2.5-2.56 (m, 1H), 5.09 (s, 2H), 5.66 (s, 2H),
7.09 (d, J=9.04Hz, 2H), 7.19 (d, J=8.32Hz 2H), 7.38 (d, J=8.12Hz, 2H),
7.91 (d, J=9.04Hz, 2H), 7.98-7.99 (m, 1H), 8.03 (s, 1H), 8.64 (d,
J=3Hz, 1H), 8.72 (d, J=1.4Hz, 1H), 13.52 (s, 1H)

5 融点 172-174 °C

実施例 3-2 乃至 3-132

実施例 3-1 と同様の方法により、また必要に応じその他常法を用いて、実施例 3-2 乃至 3-132 の化合物を製造した。得られた化合物の構造式及び物性値を、実施例 3-1 と併せて、以下の表に示した。

10

表 3-1

実施例	構造式	融点(°C)
3-1		172 - 174
3-2		204 - 207
3-3		117 - 118
3-4		アモルファス

表 3-2

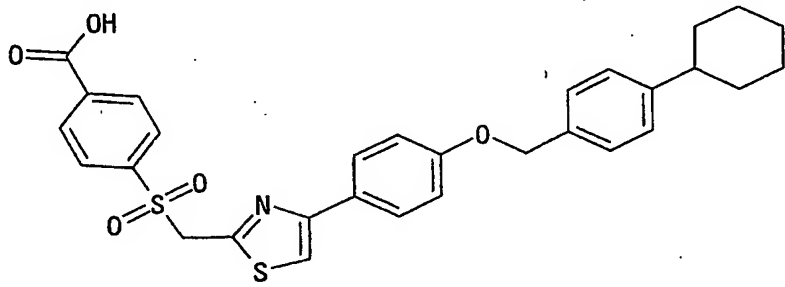
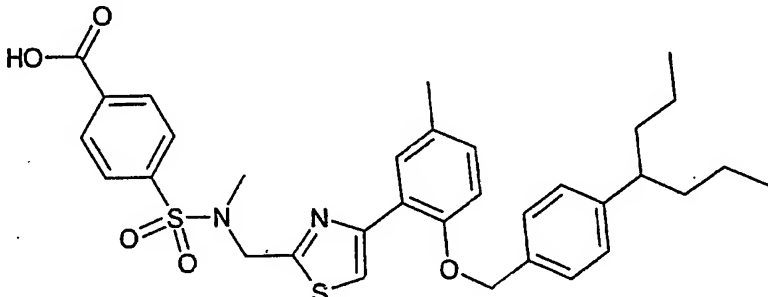
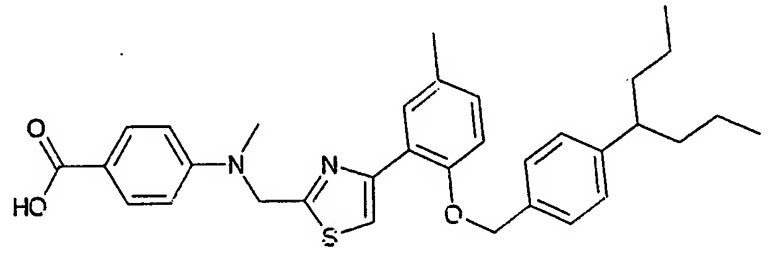
実施例	構造式	融点(°C)
3-5		アモルファス
3-6		130 - 132
3-7		184 - 187

表 3-3

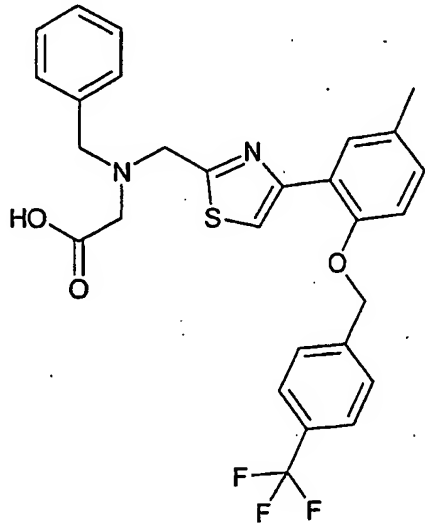
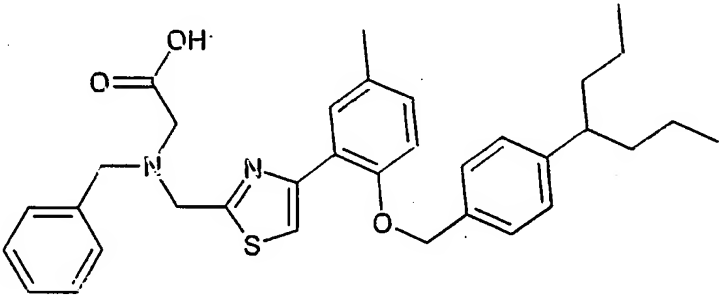
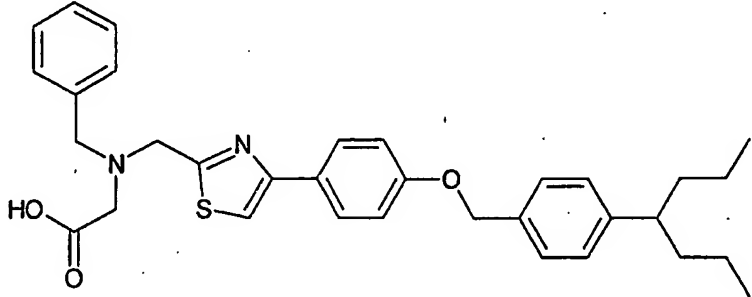
実施例	構造式	融点(°C)
3-8		168 - 170
3-9		126 - 128
3-10		145 - 148

表 3-4

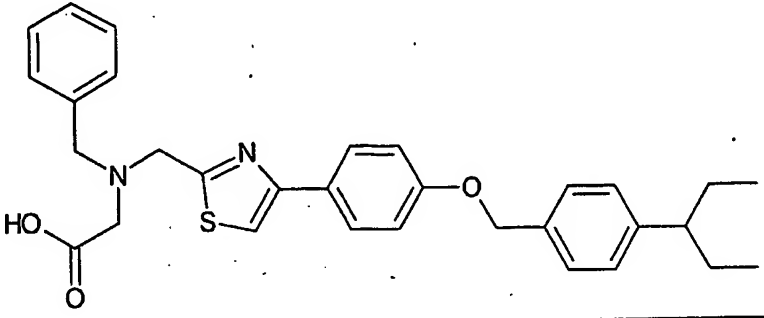
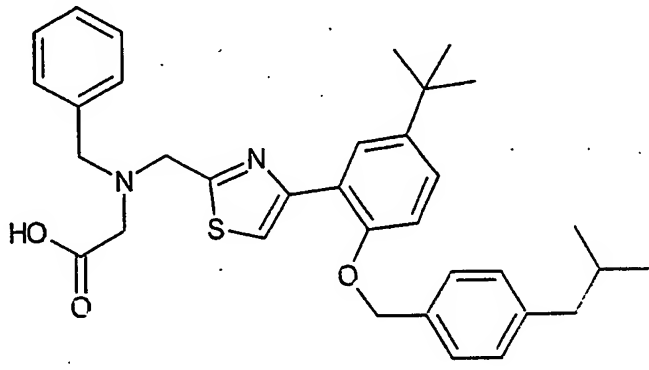
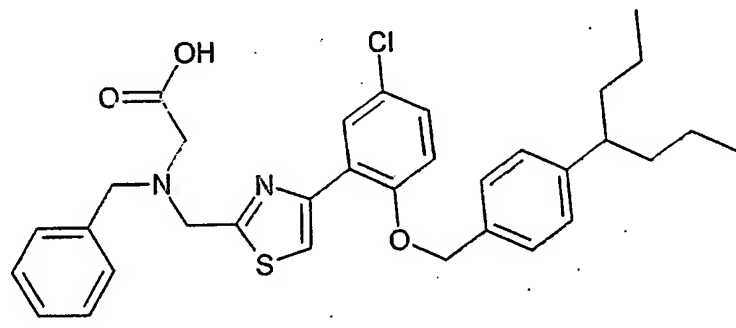
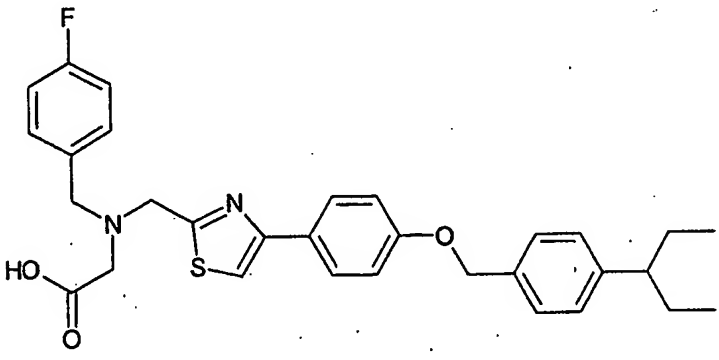
実施例	構造式	融点(°C)
3-11		144 - 146
3-12		155 - 157
3-13		130 - 131
3-14		153 - 155

表 3-5

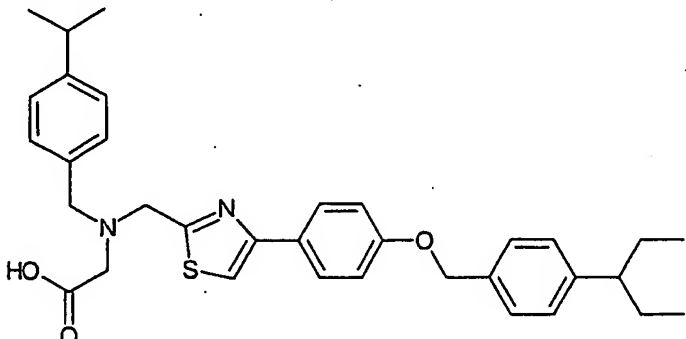
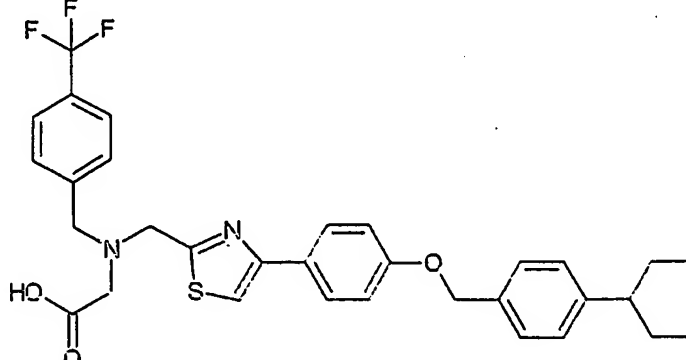
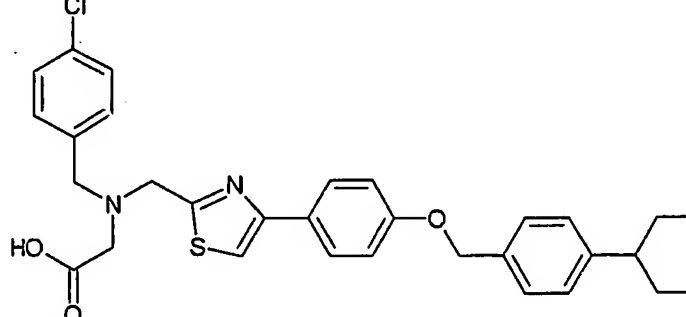
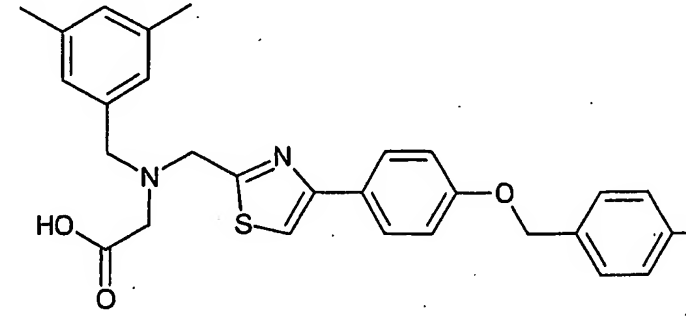
実施例	構造式	融点(°C)
3-15		138 - 140
3-16		136 - 138
3-17		154 - 157
3-18		114 - 119

表 3-6

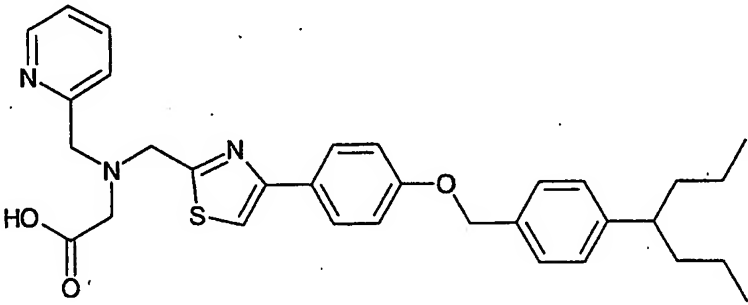
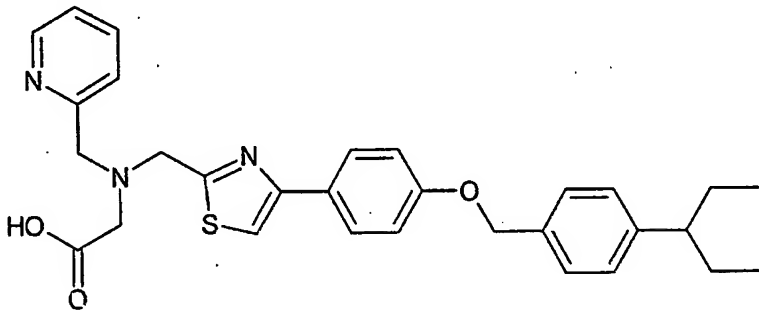
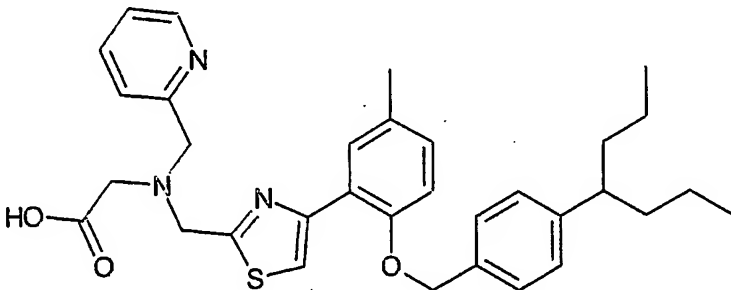
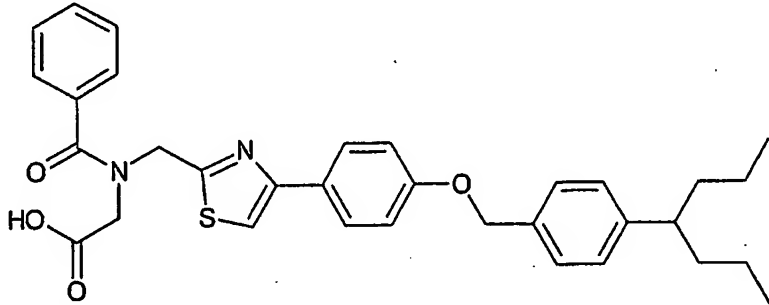
実施例	構造式	融点(°C)
3-19		155 - 156
3-20		156 - 157
3-21		118 - 120
3-22		141 - 144

表 3-7

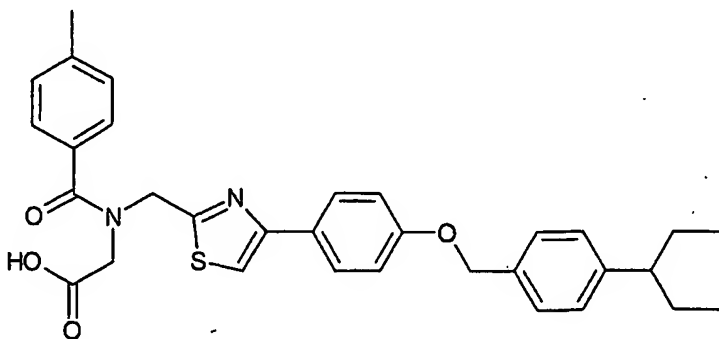
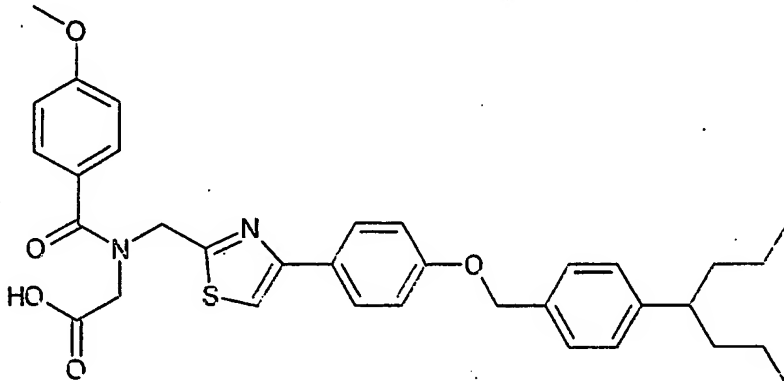
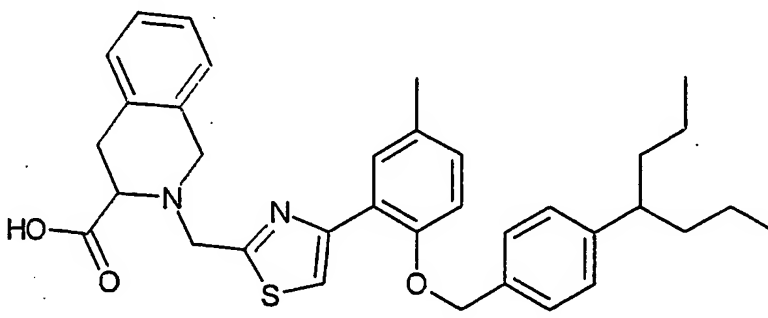
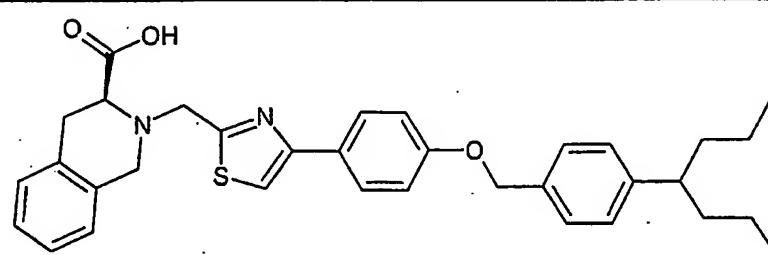
実施例	構造式	融点(°C)
3-23		142 - 144
3-24		99 - 101
3-25		149 - 152
3-26		90 - 93

表 3-8

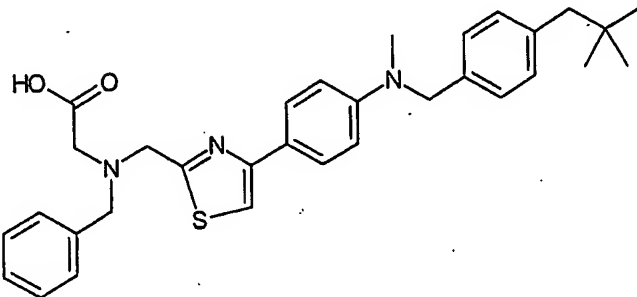
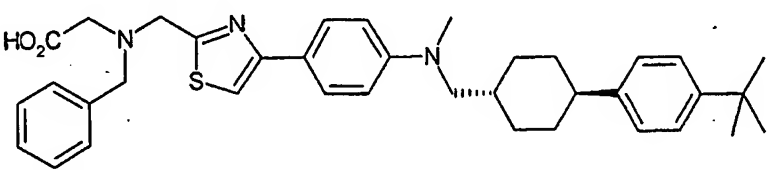
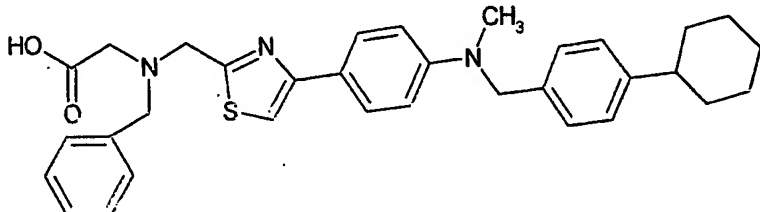
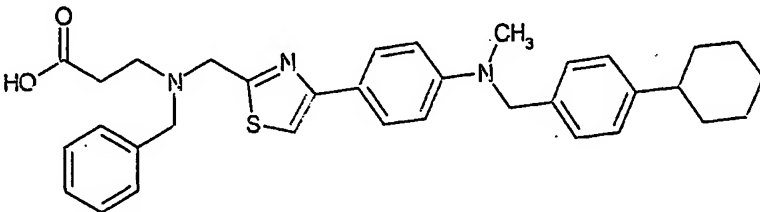
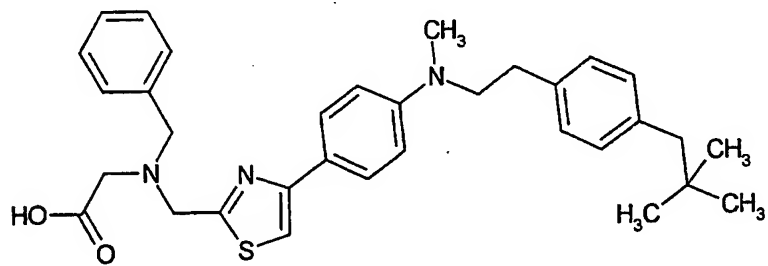
実施例	構造式	融点(°C)
3-27		159 - 160
3-28		192 - 195
3-29		148 - 150
3-30		アモルファス
3-31		133 - 134

表 3-9

実施例	構造式	融点(°C)
3-32		157 - 159
3-33		146 - 147
3-34		180 - 182
3-35		アモルファス

表 3-10

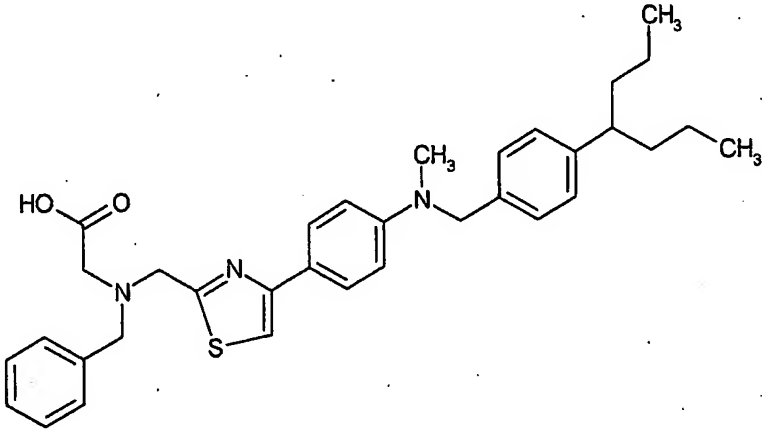
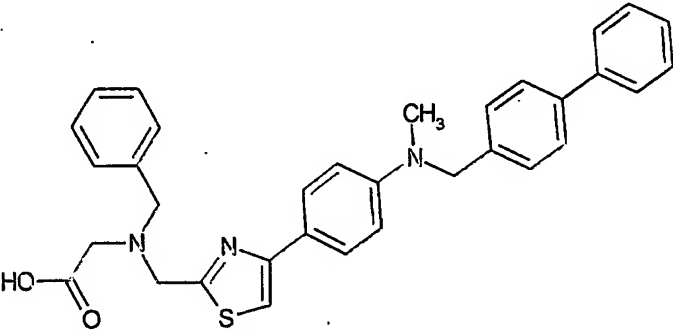
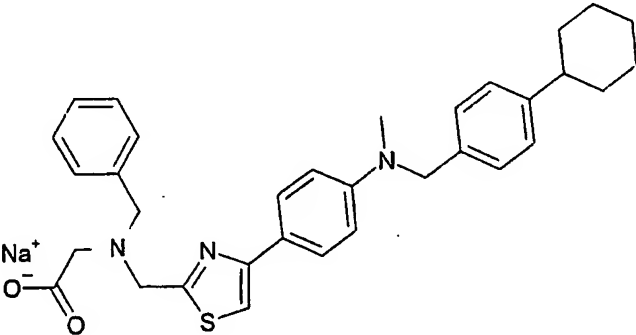
実施例	構造式	融点(°C)
3-36		アモルファス
3-37		167 - 170
3-38		250 -

表 3-11

実施例	構造式	融点(°C)
3-39		149 - 151
3-40		アモルファス
3-41		143
3-42		122

表 3-12

実施例	構造式	融点(°C)
3-43		アモルファス
3-44		74 - 78
3-45		77 - 82
3-46		82 - 87

表 3-13

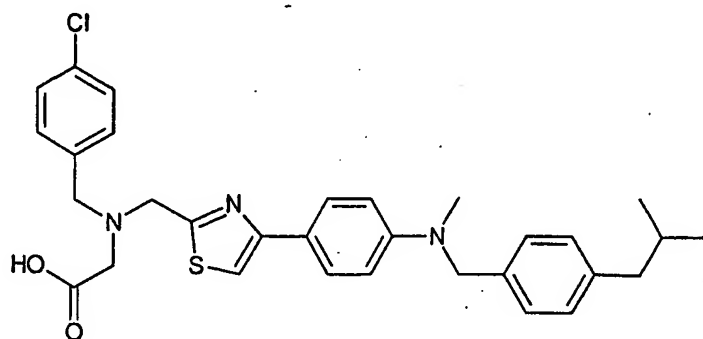
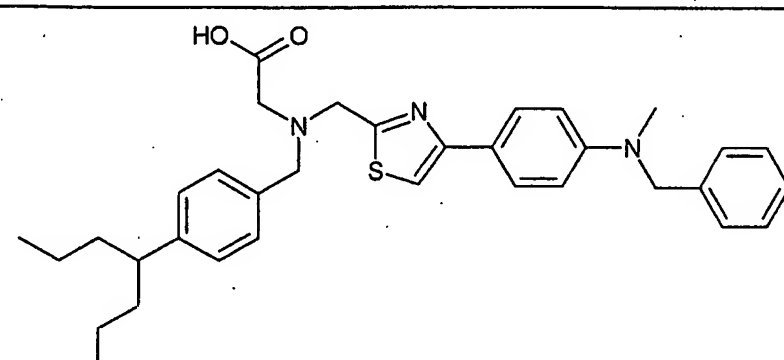
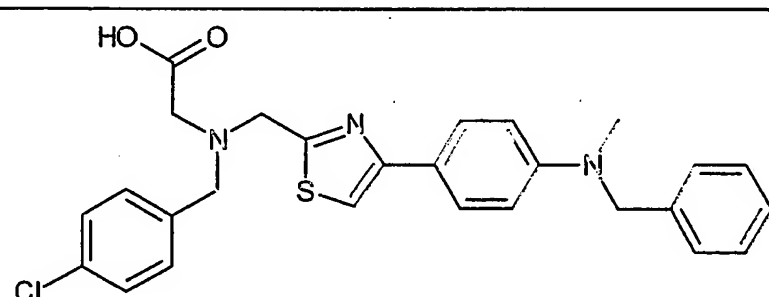
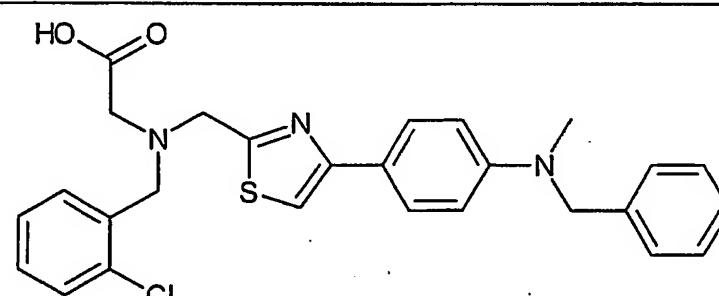
実施例	構造式	融点(°C)
3-47		153 - 157
3-48		137 - 140
3-49		140 - 142
3-50		132 - 134

表 3-14

実施例	構造式	融点(°C)
3-51		69 - 72
3-52		230 -
3-53		117 - 120
3-54		78 - 83

表 3-15

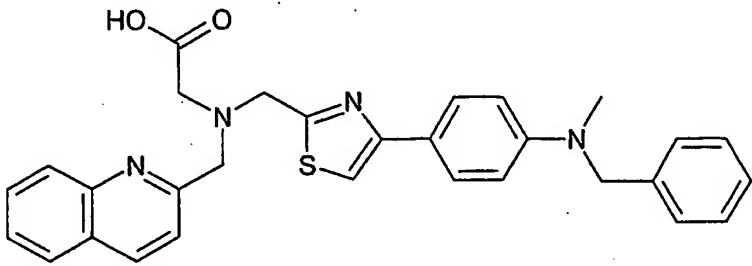
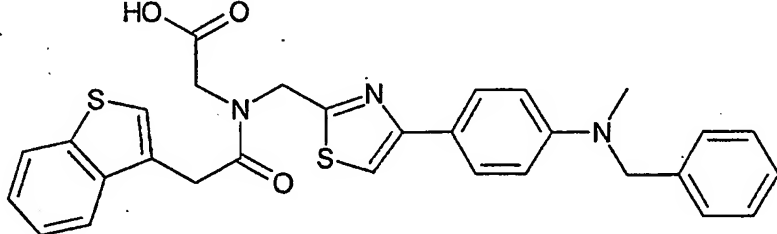
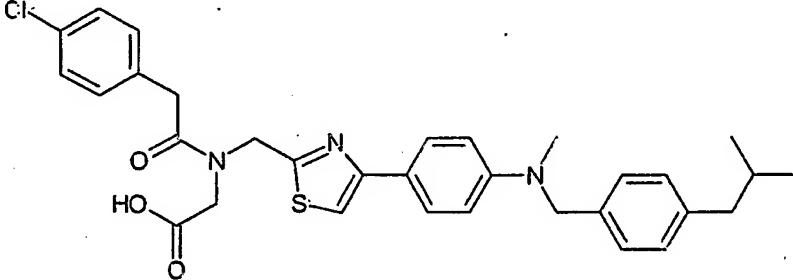
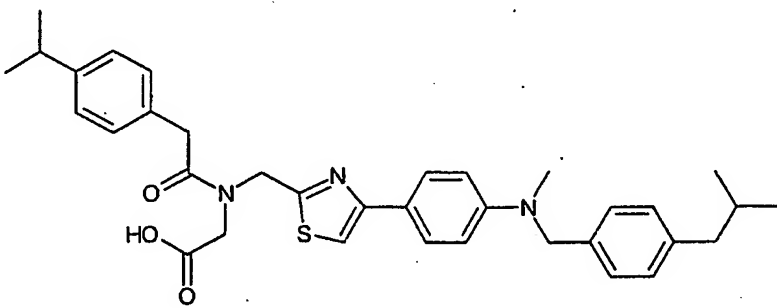
実施例	構造式	融点(°C)
3-55		144 - 147
3-56		186 - 188
3-57		150 - 152
3-58		124 - 126

表 3-16

実施例	構造式	融点(°C)
3-59		117 - 118
3-60		152 - 153
3-61		143 - 145
3-62		114 - 117

表 3-17

実施例	構造式	融点(°C)
3-63		183 - 188
3-64		186 - 187
3-65		アモルフィス
3-66		176 - 180
3-67		220 - 222

表 3-18

実施例	構造式	融点(°C)
3-68		233 - 235
3-69		229 - 231
3-70		167 - 170 (分解)
3-71		202 - 205
3-72		168 - 170

表 3-19

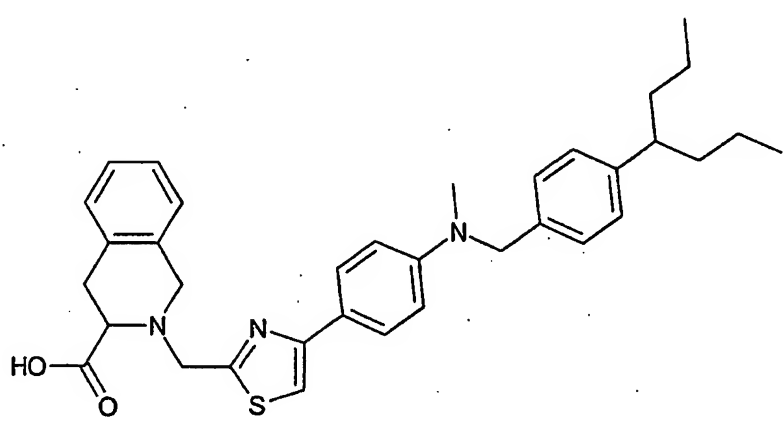
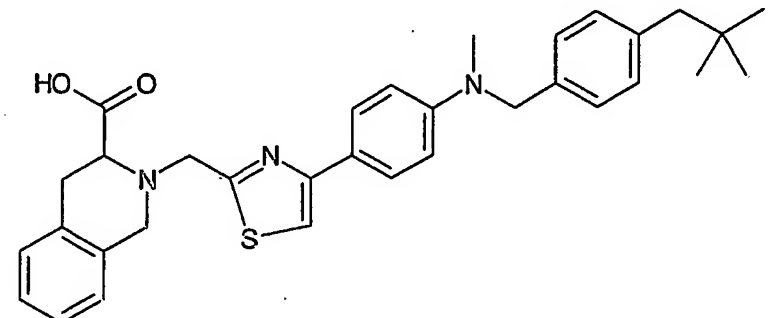
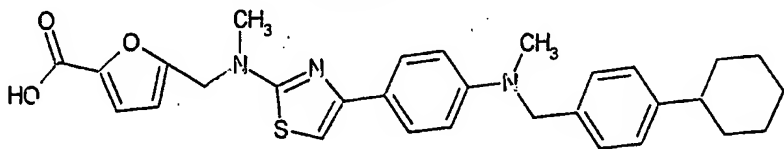
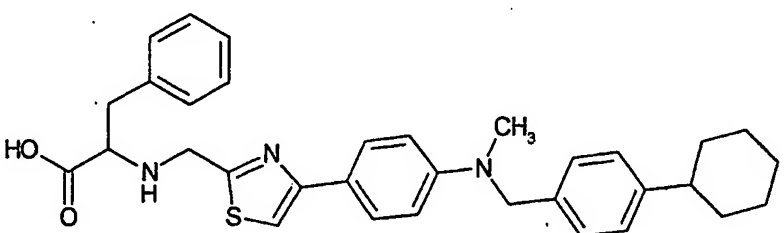
実施例	構造式	融点(°C)
3-73		176 - 179
3-74		175 - 177
3-75		156 - 161
3-76		185 - 190

表 3-20

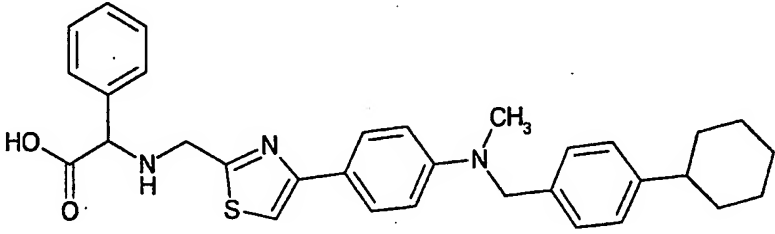
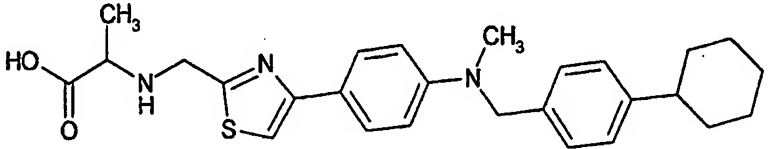
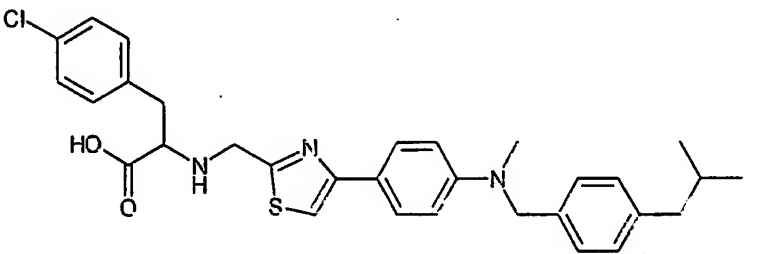
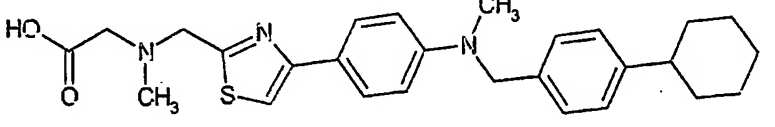
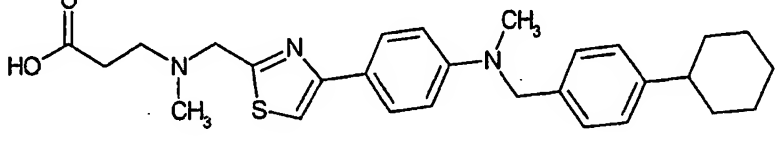
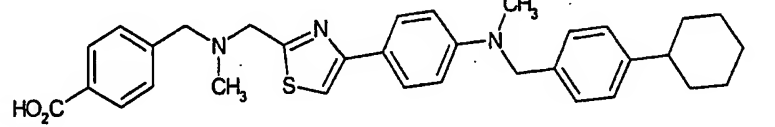
実施例	構造式	融点(°C)
3-77		183 - 186
3-78		135 - 138
3-79		199 - 204
3-80		152 - 155
3-81		アモルファス
3-82		アモルファス

表 3-21

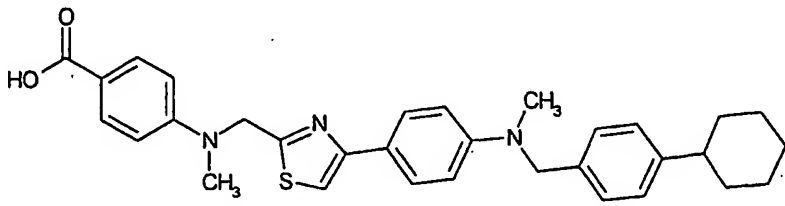
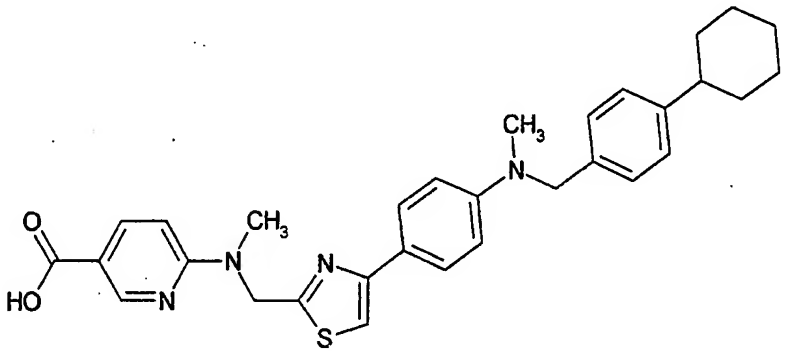
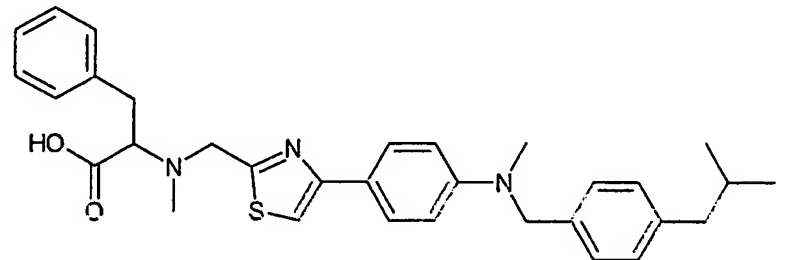
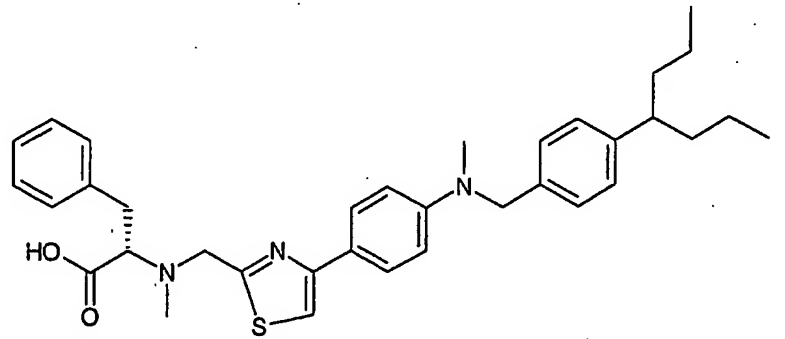
実施例	構造式	融点(°C)
3-83		アモルファス
3-84		226 - 228
3-85		138 - 139
3-86		143

表 3-22

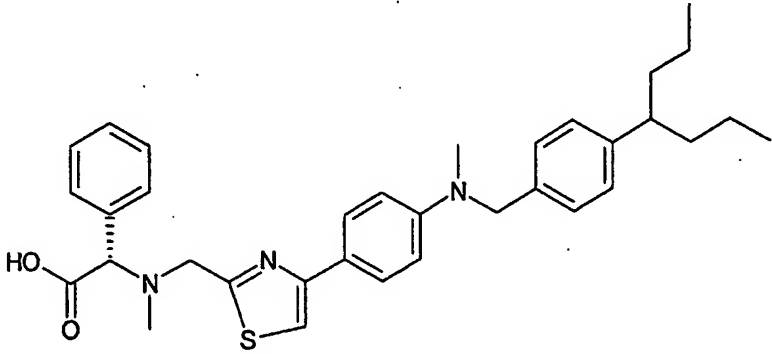
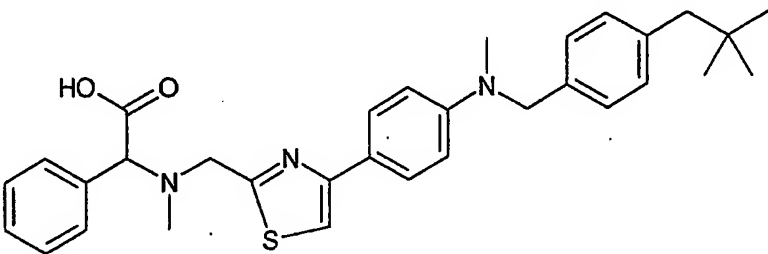
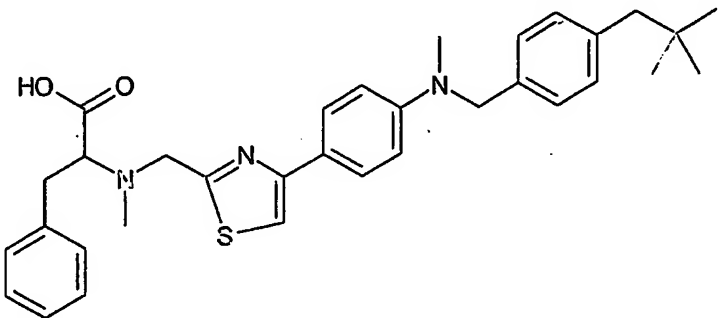
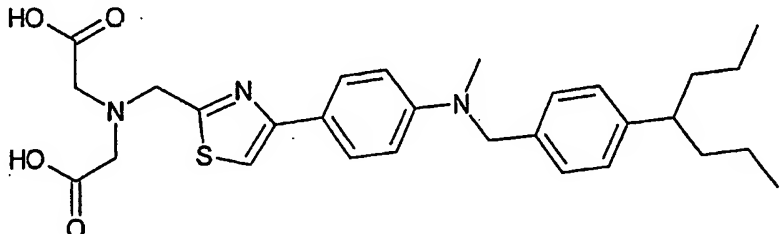
実施例	構造式	融点(°C)
3-87		146
3-88		171 - 173
3-89		160 - 161
3-90		アモルファス

表 3-23

実施例	構造式	融点(°C)
3-91		153 - 154
3-92		166 - 167
3-93		155 - 156
3-94		178 - 181
3-95		175 - 177

表 3-24

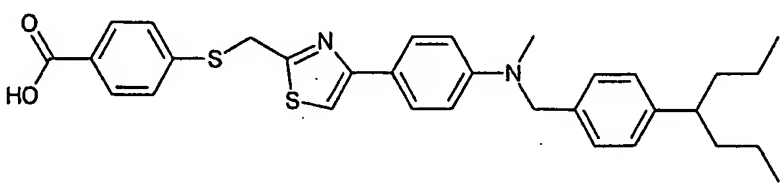
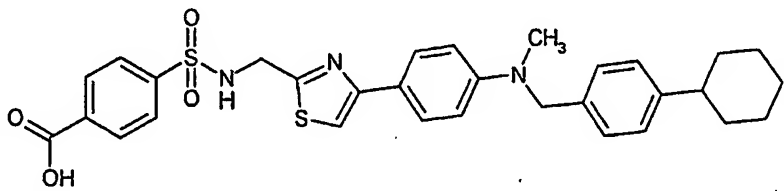
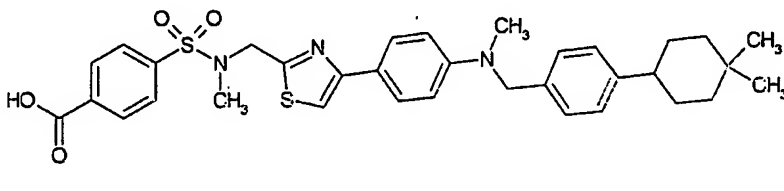
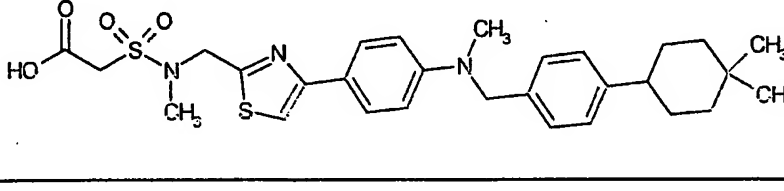
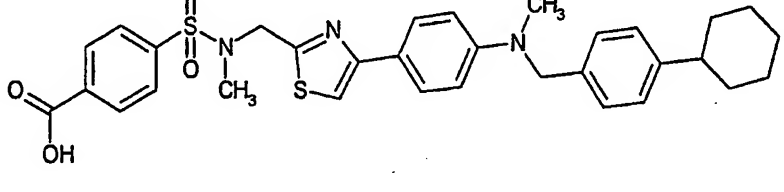
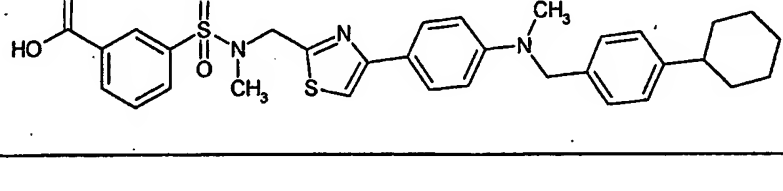
実施例	構造式	融点(°C)
3-96		126 - 127
3-97		202 - 203
3-98		218 - 221
3-99		184 - 190
3-100		193 - 196
3-101		164 - 166

表 3-25

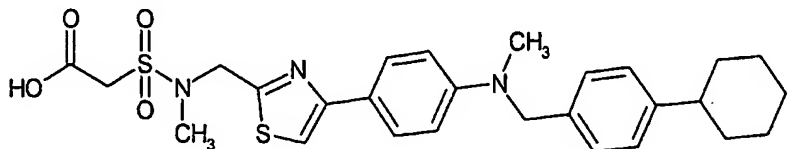
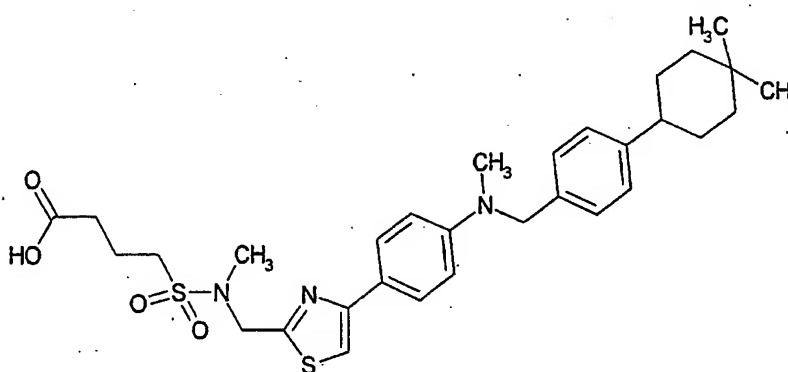
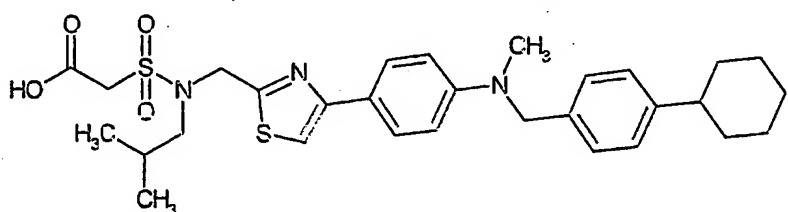
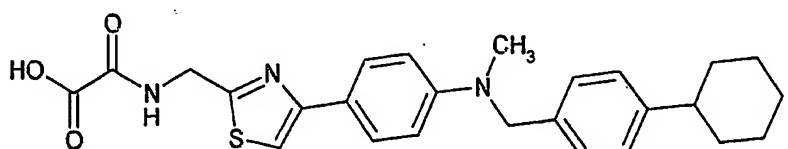
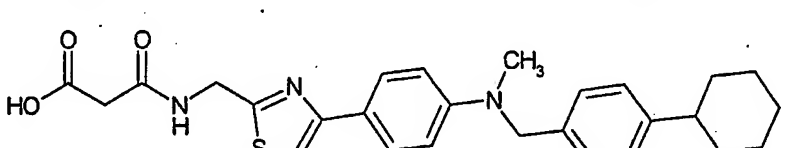
実施例	構造式	融点(°C)
3-102		178 - 183
3-103		アモルファス
3-104		104 - 110
3-105		アモルファス
3-106		アモルファス

表 3-26

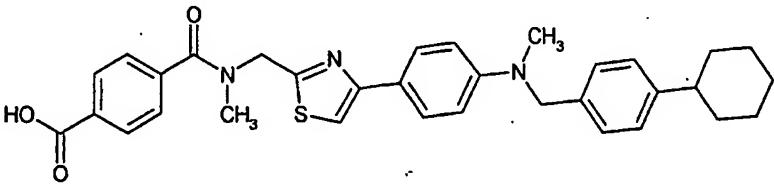
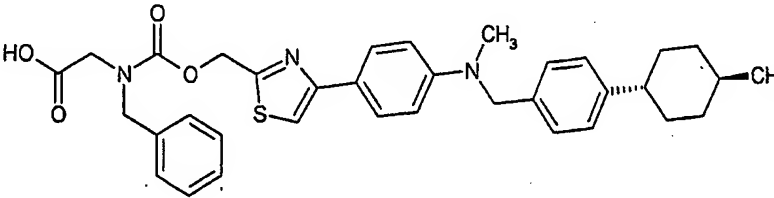
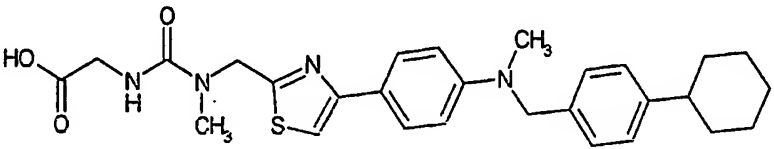
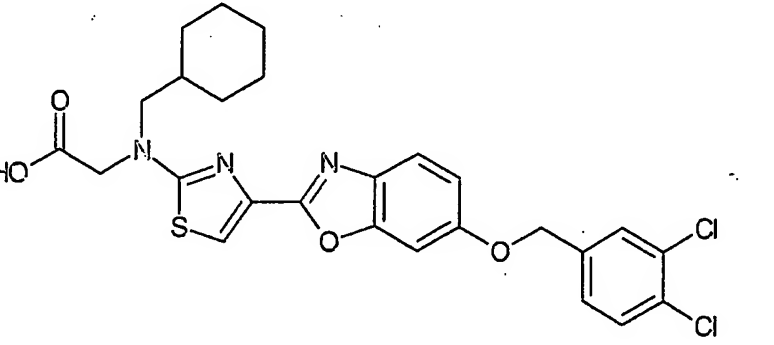
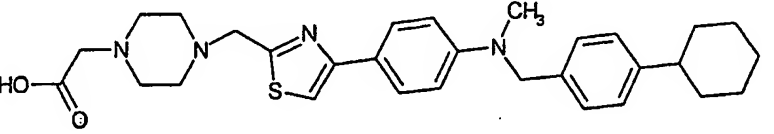
実施例	構造式	融点(°C)
3-107		162 - 164
3-108		アモルファス
3-109		149 - 150
3-110		198 - 200
3-111		190 - 191

表 3-27

実施例	構造式	融点(°C)
3-112		254 - 255
3-113		アモルファス
3-114		148 - 150
3-115		156 - 158

表 3-28

実施例	構造式	融点(°C)
3-116		アモルファス
3-117		アモルファス
3-118		127 - 130
3-119		アモルファス

表 3-29

実施例	構造式	融点(°C)
3-120		アモルファス
3-121		103 - 104
3-122		98 - 103
3-123		アモルファス

表 3-30

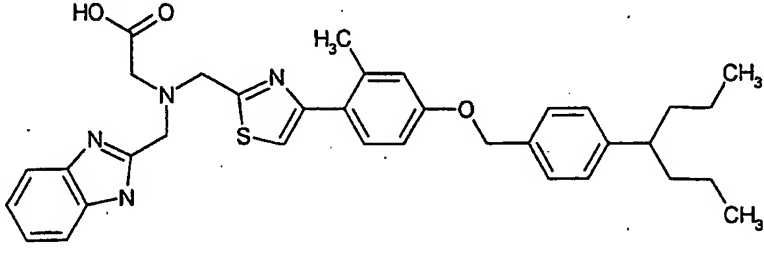
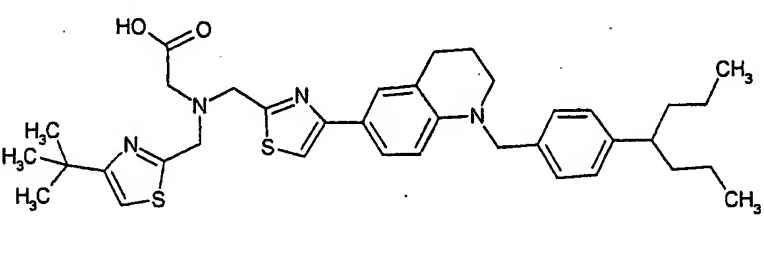
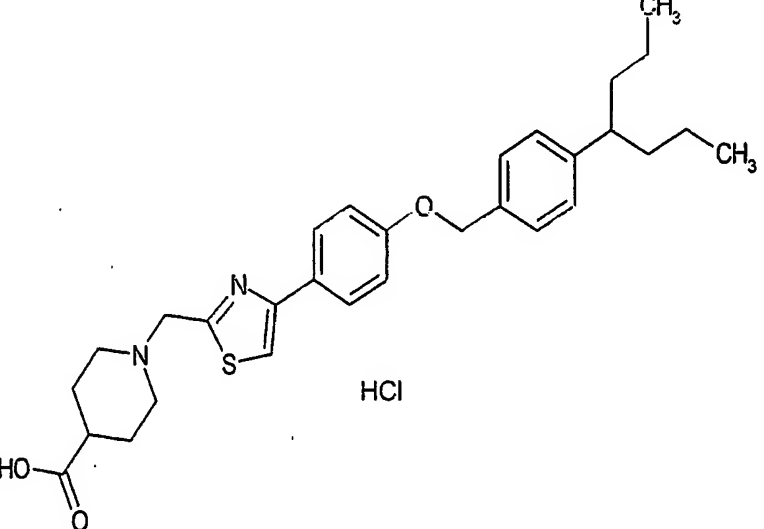
実施例	構造式	融点(°C)
3-124		アモルファス
3-125		132 - 135
3-126	 HCl	アモルファス

表 3-31

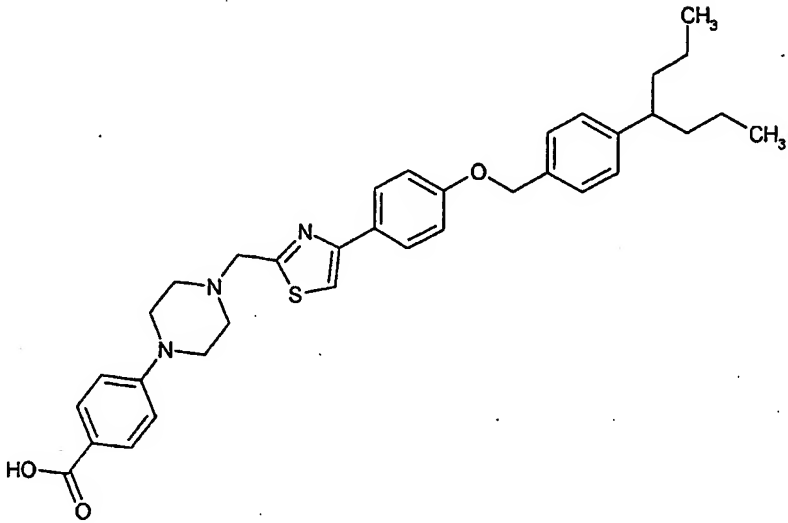
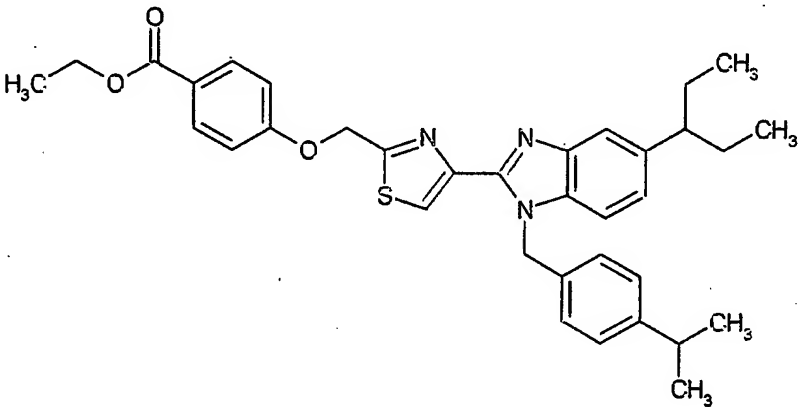
実施例	構造式	融点(°C)
3-127	 <chem>CCCC(C)Cc1ccc(OCC2=CC=C(C=C2)SC3=CC=CC=C3N4CCN(CC4)C5=CC=C(C=C5)C(=O)O)cc1</chem>	241 - 243
3-128	 <chem>CCCC(C)Cc1ccc(N2C(=N3C(=CC=C3N(C2)Cc4ccc(cc4)C(C)C)C5=CC=C(C=C5)SC6=CC=CC=C6C(=O)OCC)C5)cc1</chem>	106 - 107

表 3-32

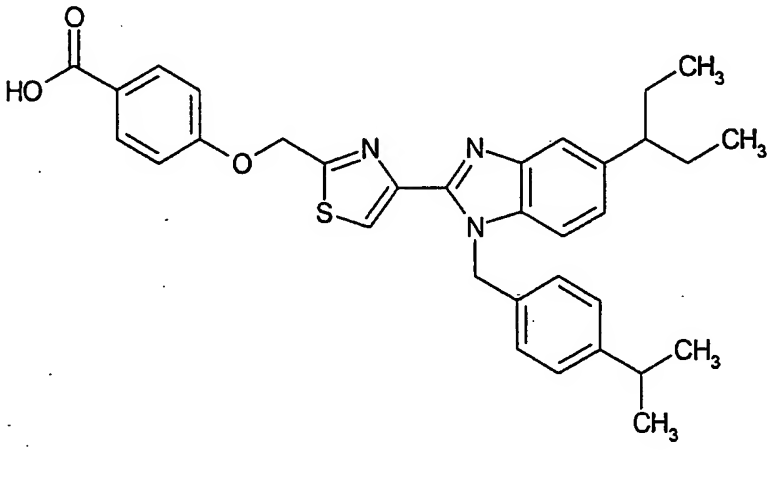
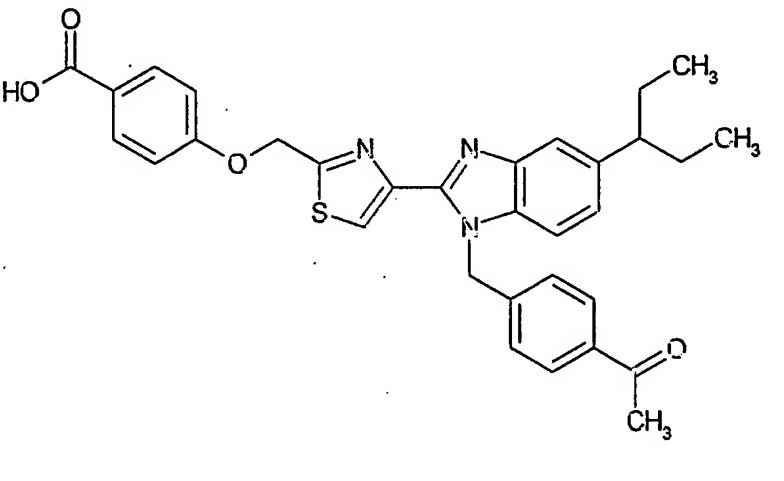
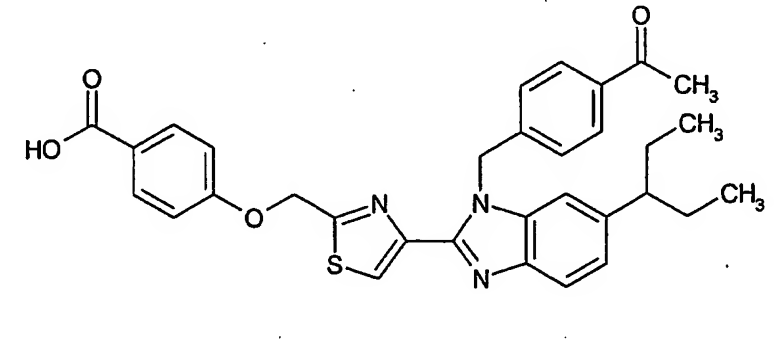
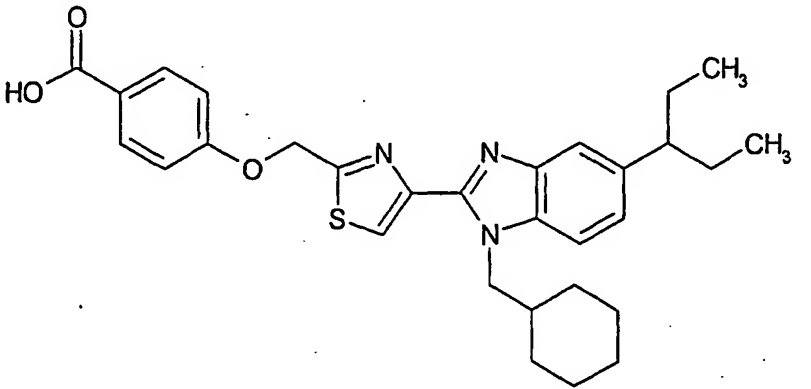
実施例	構造式	融点(°C)
3-129		139 - 142
3-130		127 - 132
3-131		138 - 139

表 3-33

実施例	構造式	融点(°C)
3-132		176 - 183

実施例 4-1

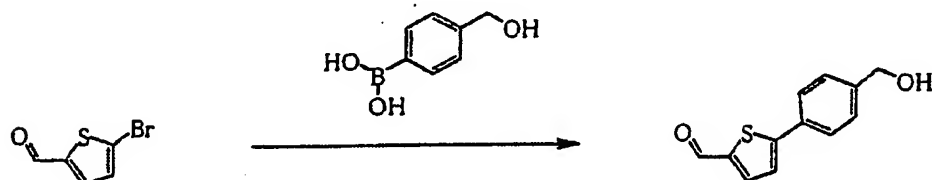
[(1-メチル-1H-ベンズイミダゾール-2-イルメチル)-5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル]-アミノ]-酢酸

- 5 (1) N-(1-メチル-1H-ベンズイミダゾール-2-イルメチル) グリシン エチルエステル・塩酸塩



- 2-クロロメチル-1-メチル-1H-ベンズイミダゾール塩酸塩 (81.135 g, 0.374 mmol) のアセトニトリル (800 ml) 懸濁液に、グリシンエチルエステル塩酸塩 (156.5 g, 1.12 mmol)、炭酸カリウム (284.1 g, 2.06 mmol)、ヨウ化カリウム (6.2 g, 0.037 mmol) を加え、75℃で1.5時間攪拌した。反応終了後、酢酸エチル、水を加え抽出し、有機層を水、飽和食塩水にて洗浄した後硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去し、得られた残渣を酢酸エチルに溶解し、4N-塩酸/酢酸エチル溶液 (93 ml) を加え、溶媒を留去した。得られた残渣に酢酸エチルを加え、生じた固体をろ取し、標題化合物 (74.4 g, 70%) を得た。

(2) 5-(4-ヒドロキシメチルフェニル)チオフェン-2-カルバルデヒド



20

- 5-ブロモチオフェン-2-カルバルデヒド (125.7 g, 0.658 mmol)、4-ヒドロキシメチルフェニルボロン酸 (100 g, 0.658 mmol)、炭酸カリウム (136.43 g, 0.987 mmol) の5.0%メタノール (880 ml) 懸濁液に、ビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)ジクロリド (4.62 g, 6.58 mmol)

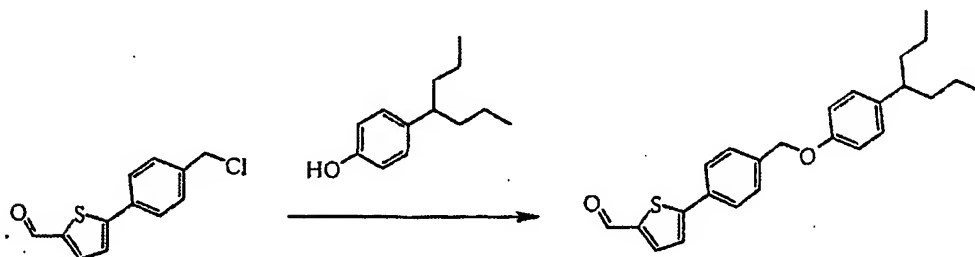
1) を加え 80℃ で 1.5 時間攪拌した。反応終了後、生じた固体をろ取した。得られた固体を減圧下乾燥し標題化合物 (137.2 g、96%) を得た。

(3) 5-(4-クロロメチルフェニル)チオフェン-2-カルバルデ
5 ヒド



実施例 4-1 (2) で得られた 5-(4-ヒドロキシメチルフェニル)チオフェン-2-カルバルデヒド (20 g, 91.6 mmol)、トリエチルアミン (15.3 ml, 110 mmol) のアセトニトリル溶液に、氷冷下メタンсульホニルクロリド (8.51 ml, 110 mmol) を滴下し、室温下 1 時間攪拌した。反応液に塩化リチウム (7.77 g, 183.3 mmol) を加えた後、55℃ で 1 時間攪拌した。反応終了後、室温下水を加え生じた固体をろ取した。得られた固体を減圧下乾燥し標題化合物 (19.3 g、89%) を得た。

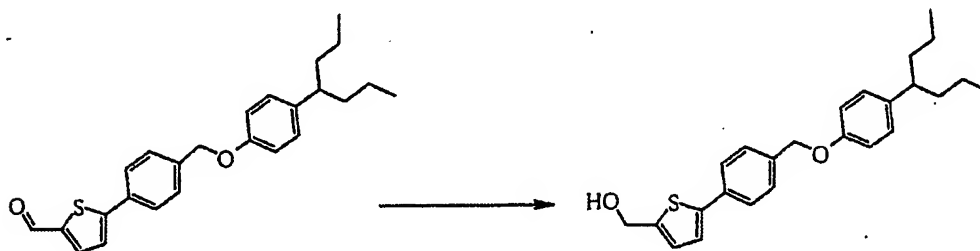
(4) 5-(4-(4-(1-プロピルブチル)フェノキシメチル)フェニル)チオフェン-2-カルバルデヒド



4-(1-プロピルブチル)フェノール (15.6 g, 81.1 mmol) の N,N-ジメチルアセトアミド (192 ml) 溶液に実施例 4-1 (3) で得られた 5-(4-クロロメチルフェニル)チオフェン-2-カルバルデヒド (19.2 g, 81.1 mmol)、炭酸カリウム (22.4 g、162.2 mmol)、ヨウ化カリウム (2.69 g、1

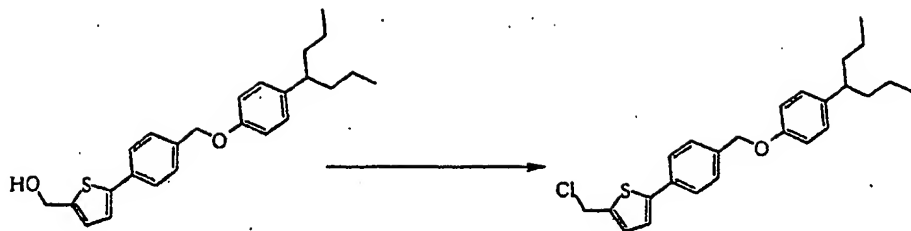
6. 2 mmol) を順次加え、90℃で1.5時間攪拌した。反応終了後、室温にて酢酸エチル、水を加え抽出し、有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を留去して得られた残渣を、ヘキサン/ジイソプロピルエーテル=3/1で攪拌し、生じた固体をろ取した。得られた固体を減圧下乾燥し標題化合物(25.9g、81%)を得た。

(5) (5-(4-(4-(1-プロピルブチル)フェノキシメチル)フェニル)チオフェン-2-イル)メタノール



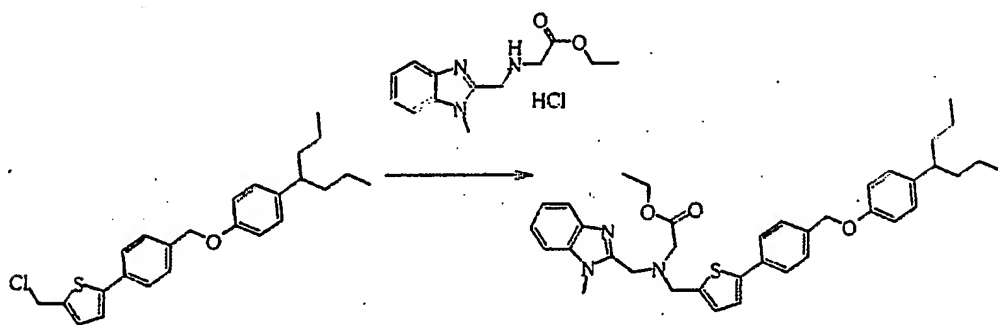
10 実施例4-1(4)で得られた5-(4-(4-(1-プロピルブチル)フェノキシメチル)フェニル)チオフェン-2-カルバルデヒド(25.9g、66mmol)のテトラヒドロフラン(260ml)及びエタノール(260ml)溶液に、氷冷下水素化ホウ素ナトリウム(2.5g、66mmol)を加え、室温下0.5時間攪拌した。反応
15 終了後、溶媒を一部濃縮して得られた残渣に酢酸エチル、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、水を加え0.5時間攪拌し抽出、有機層を飽和食塩水にて洗浄した後、硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(クロロホルム：メタノール=50：1→10：1)にて精製し、標題化合物(23.6g、
20 91%)を得た。

(6) (5-(4-(4-(1-プロピルブチル)フェノキシメチル)フェニル)チオフェン-2-イル)メチルクロライド



実施例 4-1 (5) で得られた (5-(4-(4-(1-プロピルブ
チル)フェノキシメチル)フェニル)チオフェン-2-イル)メタノー
ル (23.6 g、59.8 mmol) のクロロホルム (354 ml) 溶
5 液に室温下塩化チオニル (8.73 ml、11.96 mmol) を加え、
同温下1時間攪拌した。反応終了後、溶媒を留去して得られた残渣にク
ロロホルムを加え濃縮した後、減圧下乾燥し標題化合物 (24.6 g、
100%) を得た。

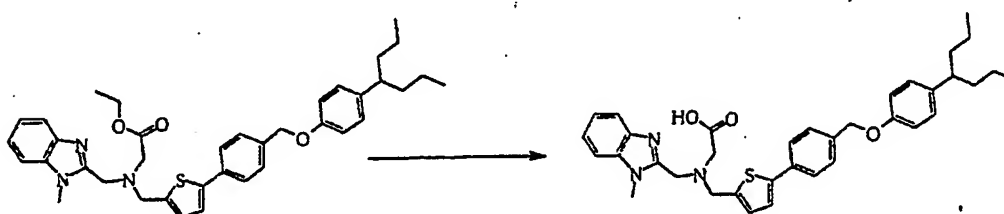
(7) [(1-メチル-1H-ベンズイミダゾール-2-イルメチル)-
10 5-{4-[4-(1-プロピルブチル)-フェノキシメチル]-フェ
ニル)-チオフェン-2-イルメチル]-アミノ]-酢酸 エチルエ
ステル



実施例 4-1 (6) で得られた (5-(4-(4-(1-プロピルブ
15 チル)フェノキシメチル)フェニル)チオフェン-2-イル)メチルク
ロライド (0.687 g、1.66 mmol) のアセトニトリル溶液に、
実施例 4-1 (1) で得られた N-(1-メチル-1H-ベンズイミダ
ゾール-2-イルメチル)グリシン エチルエステル・塩酸塩 (0.6
74 g、1.83 mmol)、炭酸カリウム (0.69 g、5.0 mmol)
20 1)、ヨウ化カリウム (0.055 g、0.33 mmol) を加え、8
0℃で1.5時間攪拌した。反応終了後、酢酸エチル、水を加え抽出し、

有機層を飽和食塩水にて洗浄した後硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール＝１００：１→２０：１）にて精製し、標題化合物（０．６３３ｇ、６１％）を得た。

- 5 (8) [(1-メチル-1H-ベンズイミダゾール-2-イルメチル)-5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル]-アミノ]-酢酸



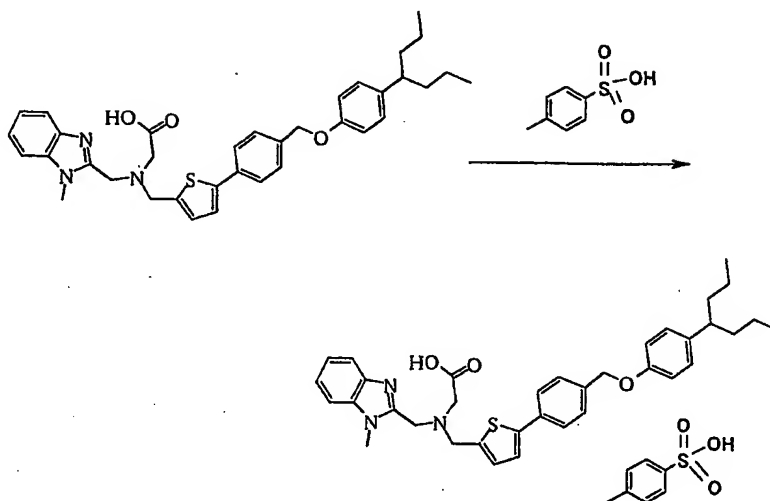
- 10 実施例４－１（７）で得られた[(1-メチル-1H-ベンズイミダゾール-2-イルメチル)-5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル]-アミノ]-酢酸 エチルエステル（５ｇ、８．０１mmol）の５０％テトラヒドロフラン-エタノール（１００ml）溶液に、室温下１N-
- 15 水酸化ナトリウム水溶液（１６ml）を加え、８０℃で１時間撹拌した。反応終了後、氷冷下１N-塩酸（１６ml）を加え、室温撹拌し生じた固体をろ取した。得られた固体を減圧下乾燥し標題化合物（４．６３ｇ、９７％）を得た。

- 1H NMR (DMSO-d₆, 300 MHz) δ 0.79 (t, J = 7.3 Hz, 6 H), 0.96-1.18 (m, 4 H), 1.34- 1.60 (m, 4 H), 3.36 (s, 2 H), 3.88 (s, 3 H), 4.04 (s, 2 H), 4.16 (s, 2 H), 5.06 (s, 2 H), 6.92 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.01 (d, J = 3.4 Hz, 1 H), 7.07 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.14-7.26 (m, 2 H), 7.35 (d, J = 3.4 Hz, 1 H), 7.46 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 7.53 (d, J = 7.5 Hz, 1 H), 7.58- 7.65 (m, 3 H), 12.52 (br s, 1 H)
- 25

実施例４－４０

[(1-メチル-1H-ベンズイミダゾール-2-イルメチル)-5-

{ 4 - [4 - (1 - プロピル - ブチル) - フェノキシメチル] - フェニル } - チオフェン - 2 - イルメチル] - アミノ] - 酢酸 p - トルエン
スルホン酸塩



5 実施例 4 - 1 で得られた [(1 - メチル - 1 H - ベンズイミダゾール - 2 - イルメチル) - 5 - { 4 - [4 - (1 - プロピル - ブチル) - フェノキシメチル] - フェニル } - チオフェン - 2 - イルメチル] - アミノ] - 酢酸 (2 0 0 m g , 0 . 3 3 6 m m o l) の 2 - ブタノン (5 m l) 懸濁液に、p - トルエンスルホン酸 1 水和物 (6 4 m g , 0 . 3 7 m m o l) を加え、3 0 分間室温撹拌した。結晶をろ取、乾燥して標題化合物 (2 3 1 m g , 9 0 %) を得た。

1H NMR (DMSO-d₆, 300 MHz) δ 0.79(t, J=7.3Hz, 6H), 0.95-1.20(m, 4H), 1.32-1.60(m, 4H), 2.28(s, 3H), 2.40-2.54(m, 1H), 3.62(s, 2H), 4.00(s, 3H), 4.19(s, 2H), 4.46(s, 2H), 5.05(s, 2H), 6.92(d, J=8.6Hz, 2H), 6.98-7.14(m, 5H), 7.25(d, J=3.6Hz, 1H), 7.36-7.58(m, 8H), 7.76(d, J=9.0Hz, 1H), 7.89(d, J=9.0Hz, 1H)

融点 1 0 0 ° C - 1 3 5 ° C

実施例 4 - 2

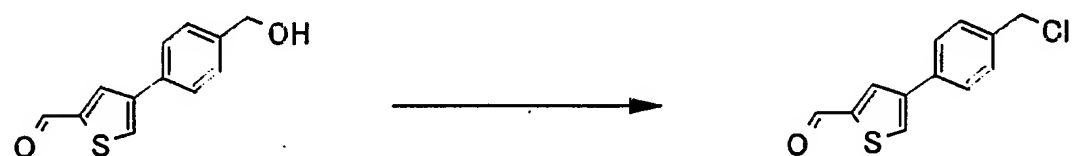
5 - (4 - { 4 - [4 - (1 - プロピル - ブチル) - フェノキシメチル] - フェニル } - チオフェン - 2 - イルメトキシ) - ニコチン酸

(1) 4 - (4 - ヒドロキシメチルフェニル) チオフェン - 2 - カルバ
ルボヒド

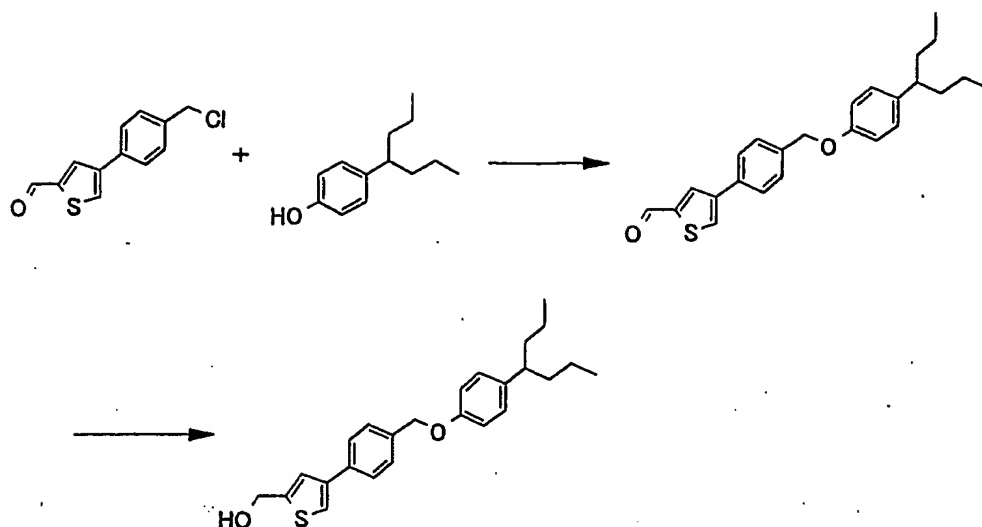


- 4-ブロモチオフェン-2-カルバルデヒド (100 g、0.523 mol) のテトラヒドロフラン (500 ml) 溶液に、ビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム (II) ジクロリド (3.67 g、5.23 mmol)、4-ヒドロキシメチルフェニルボロン酸 (79.5 g、0.523 mol)、炭酸水素ナトリウム (66.0 g、0.786 mol)、水 (1000 ml) を加え内温 62~63℃ で 3 時間攪拌した。放冷後、反応液に酢酸エチルを加え、有機層を飽和食塩水で洗浄、濃縮して粗生成物 140 g を得た。得られた粗生成物にトルエン (400 ml)、ヘキサン (100 ml) を加え、攪拌した。固体をろ取、乾燥して標題化合物 (95.4 g、83%) を得た。

(2) 4-(4-(4-(2-(4-hydroxymethylphenyl)thien-2-yl)but-3-en-2-yl)phenyl)phenol

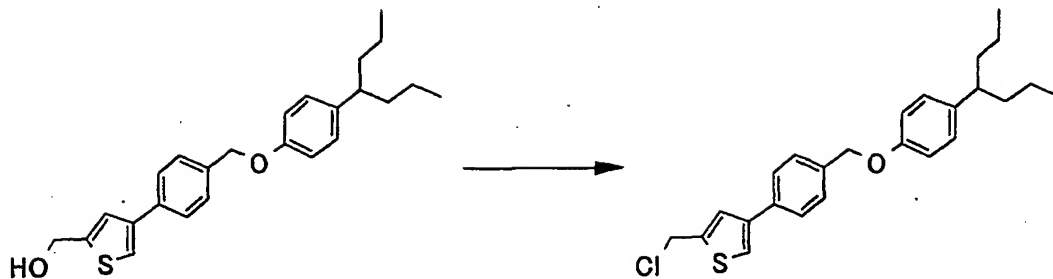


- 4-(4-(4-(2-(4-hydroxymethylphenyl)thien-2-yl)but-3-en-2-yl)phenyl)phenol (95.4 g、0.437 mol)、トリエチルアミン (73.1 ml、0.524 mol) の N,N-ジメチルホルムアミド (763 ml) 溶液に、氷冷下メタンスルホンクロリド (40.6 ml、0.524 mol) を滴下し、室温下 2 時間攪拌した。反応液に塩化リチウム (37.1 g、0.874 mol) を加えた後、60℃ で 1 時間攪拌した。放冷後、水を加え生じた固体をろ取した。得られた固体をジイソプロピルエーテル (465 ml) に懸濁し、内温 60~65℃ で 1.5 時間攪拌した。放冷後、固体をろ取、乾燥して標題化合物 (83.2 g、80%) を得た。
- (3) 4-(4-(4-(4-(1-propylbutyl)phenoxy)but-3-en-2-yl)phenyl)phenol

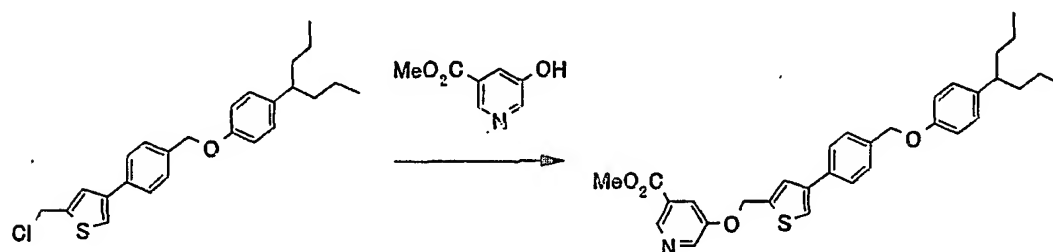


4- (4-クロロメチルフェニル) チオフェン-2-カルバルデヒド
 (21.1 g, 88.9 mmol) のN, N-ジメチルアセトアミド
 (105 ml) 溶液に4- (1-プロピルブチル) フェノール (18.
 5 7 g, 97.8 mmol)、炭酸カリウム (36.8 g, 267 mmol)
 1)、ヨウ化カリウム (1.47 g, 8.89 mmol) を順次加え、9
 0℃で1.5時間攪拌した。反応終了後、室温にて酢酸エチル、水を加
 え抽出し、有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し硫酸マグネシウムで乾
 燥した。溶媒を留去して得られた残渣 (68 g) をエタノール (100
 10 ml) に溶解し、氷冷下、水素化ホウ素ナトリウム (37.8 g, 38.
 9 mmol) を加え、室温で1時間攪拌した。反応液に水、酢酸エチル
 を加え、有機層を1N-水酸化ナトリウム水溶液、水、飽和食塩水で順
 次洗浄し硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を留去して得られた残渣を
 シリカゲルカラムクロマトグラフィー (クロロホルム：メタノール=1
 15 00：1→50：1) にて精製し、粗成生物 (29.9 g) を得た。粗
 成生物 (14.5 g) をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (酢酸エ
 チル：ヘキサン=1：5→1：4) にて精製し、標題化合物 (11.9
 g) を得た。

(4) (4- (4- (4- (1-プロピルブチル) フェノキシメチル) フ
 20 エニル) チオフェン-2-イル) メチルクロライド



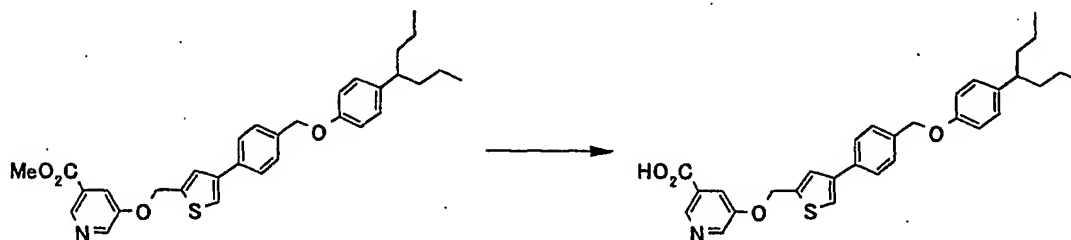
- (4-(4-(4-(1-プロピルブチル)フェノキシメチル)フェニル)チオフェン-2-イル)メタノール (11.9 g、30.2 mmol) のクロロホルム (60 ml) 溶液に、塩化チオニル (4.40 ml、60.4 mmol) を加え、30 分間室温で攪拌した。溶媒を留去して、塩化チオニル (10.0 ml、137 mmol) を加え、20 分間室温で攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣にクロロホルムを加え濃縮し、標題化合物 (12.5 g、100%) を得た。
- 10 (5) 5-(4-{4-[4-(1-プロピルブチル)フェノキシメチル]フェニル}チオフェン-2-イルメトキシ)ニコチン酸メチルエステル



- (4-(4-(4-(1-プロピルブチル)フェノキシメチル)フェニル)チオフェン-2-イル)メチルクロライド (5.00 g、12.1 mmol) に N, N-ジメチルアセトアミド (25 ml)、5-ヒドロキシニコチン酸メチルエステル (2.04 g、13.3 mmol)、炭酸セシウム (11.8 g、36.3 mmol)、ヨウ化カリウム (201 mg、1.21 mmol)、テトラ-n-ブチルアンモニウムプロミド (390 mg、1.21 mmol) を加え、60℃で1.5時間攪拌した。放冷後、酢酸エチルを加え、水、飽和食塩水で順次洗浄した。濃縮後、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル：ヘキサン=2：5
- 15
- 20

→ 1 : 2) にて精製し、標題化合物 (5.19 g、81%) を得た。

(6) 5-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメトキシ)-ニコチン酸



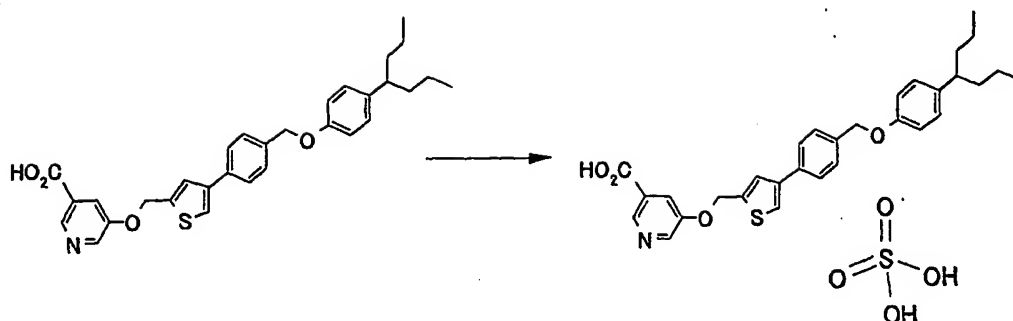
- 5 5-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメトキシ)-ニコチン酸
メチルエステル (5.04 g、9.52 mmol) にテトラヒドロフラン
(25 ml)、エタノール (25 ml)、2N-水酸化ナトリウム水溶液
(5.00 ml、10 mmol) を加え、60℃で1.5時間攪拌した。
- 10 放冷後、2N-塩酸 (5.00 ml、10 mmol)、水 (30 ml) を
加え、析出した固体をろ取、乾燥して、標題化合物 (4.77 g、収率
97%) を得た。

- 1H NMR (DMSO-d₆, 300 MHz) δ 0.80 (t, J=7.3 Hz, 6H), 1.00-1.12 (m, 4H), 1.38-1.57 (m, 4H), 2.40-2.50 (m, 1H), 5.07 (s, 2H), 5.48 (s, 2H),
15 6.93 (d, J=8.6 Hz, 2H), 7.07 (d, J=8.6 Hz, 2H), 7.49 (d, J=7.9 Hz, 2H),
7.70-7.70 (m, 1H), 7.72 (d, J=8.3 Hz, 2H), 7.88-7.89 (m, 1H), 7.91 (d,
J=1.5 Hz, 1H), 8.56 (d, J=2.6 Hz, 1H), 8.69 (d, J=1.5 Hz, 1H),
13.41 (brs, 1H)

融点 157-159℃

20 実施例 4-41

5-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメトキシ)-ニコチン酸 硫酸塩



実施例 4-2 で得られた 5-(4-{4-[4-(1-プロピルブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメトキシ)-ニコチン酸 (200 mg、0.388 mmol) の 2-ブタノ
 5 ン (2 ml) 懸濁液に、濃硫酸 (0.0207 ml、0.388 mmol) を加え、1 時間室温攪拌した。固体を、ろ取、乾燥して、標題化合物 (224 mg、収率 94%) を得た。

¹H NMR (DMSO-d₆, 300 MHz) 0.80(t, J=7.3Hz, 6H), 0.98-1.15(m, 4H),
 1.38-1.59(m, 4H), 2.39-2.54(m, 1H), 5.07(s, 2H), 5.52(s, 2H),
 10 6.93(d, J=8.6Hz, 2H), 7.07(d, J=8.7Hz, 2H), 7.49(d, J=6.3Hz, 2H),
 7.71(s, 1H), 7.72(d, J=6.4Hz, 2H), 7.93(d, J=1.5Hz, 1H), 8.00(brs,
 1H), 8.65-8.67(m, 1H), 8.73-8.76(m, 1H)

融点 125℃ (分解)

実施例 4-3 乃至 4-39 及び 4-42 乃至 4-107

15 実施例 4-1、4-2、4-40 又は 4-41 と同様の方法により、
 また必要に応じその他常法を用いて、実施例 4-3 乃至 4-39 及び実
 施例 4-42 乃至 4-107 の化合物を製造した。得られた化合物の構
 造式及び物性値を、実施例 4-1、4-2、4-40 及び 4-41 と合
 わせて、以下の表に示した。

表 4-1

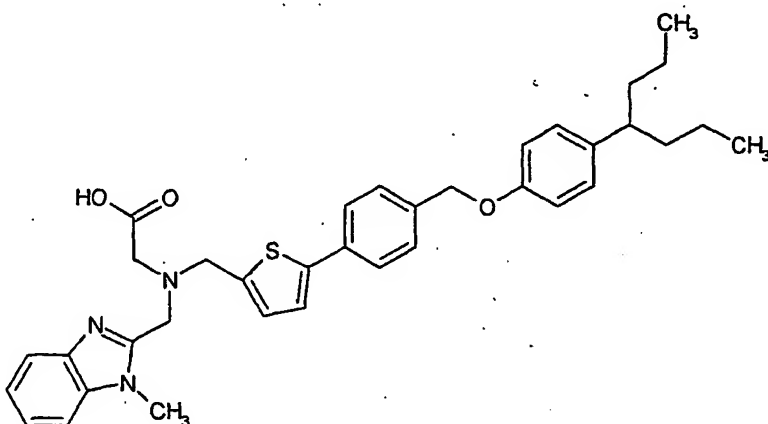
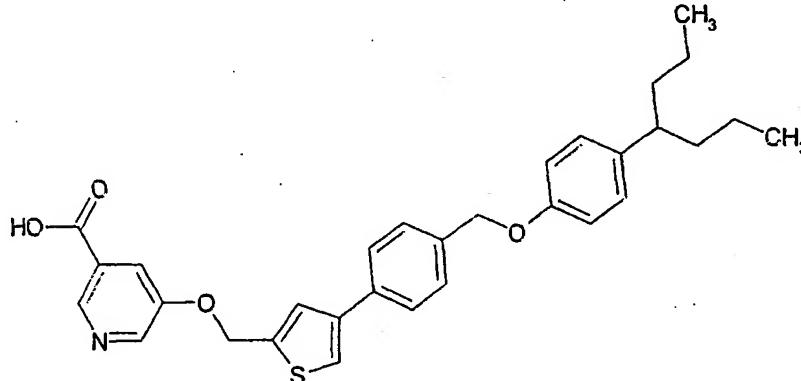
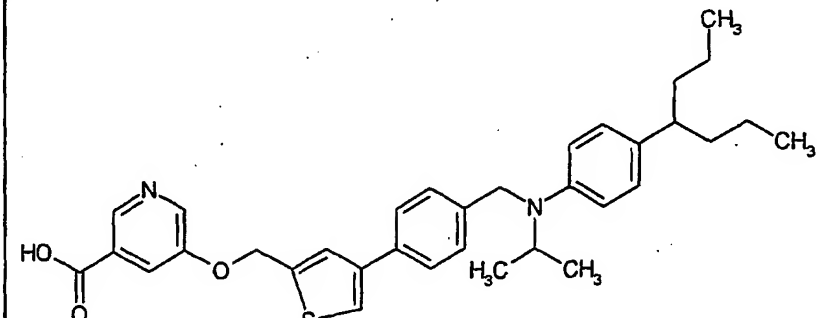
実施例	構造式	融点(°C)
4-1		アモルファス
4-2		157 - 159
4-3		156

表 4-2

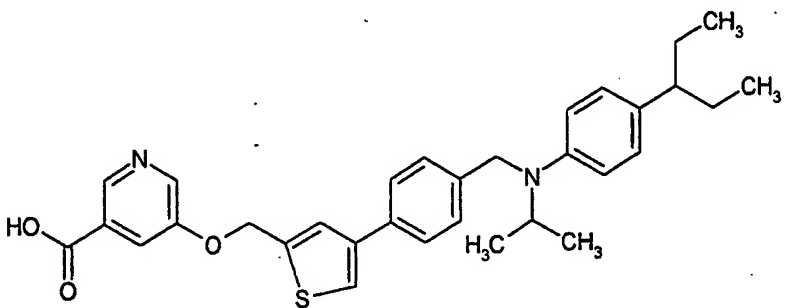
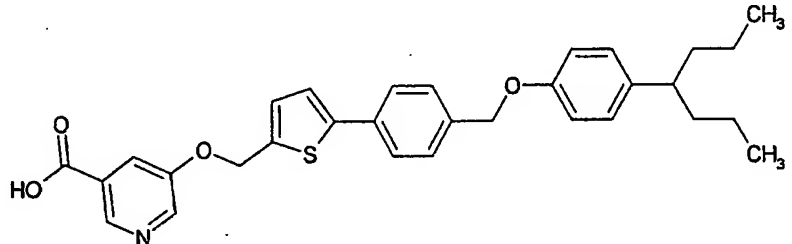
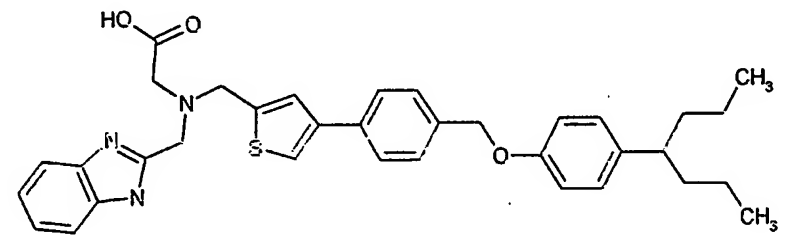
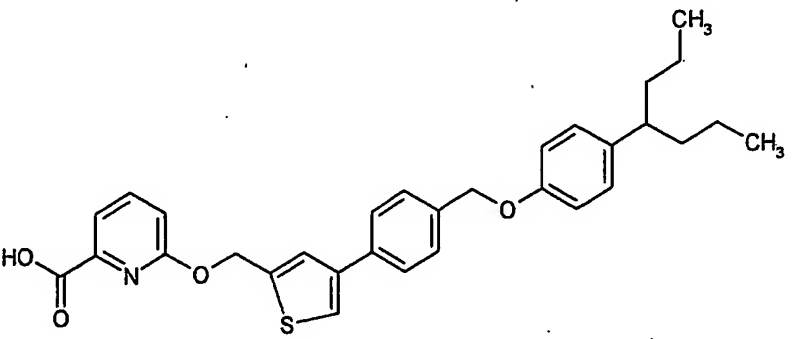
実施例	構造式	融点(°C)
4-4		160
4-5		153 - 155
4-6		153 - 155
4-7		アモルファス

表 4-3

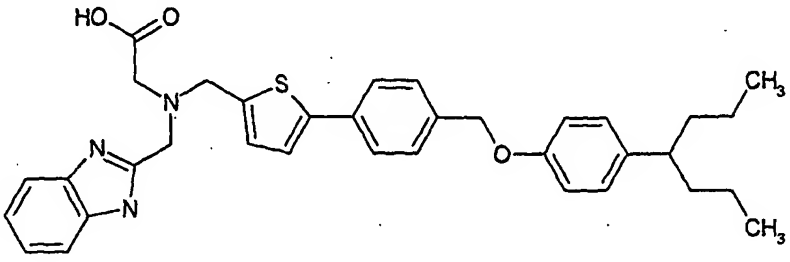
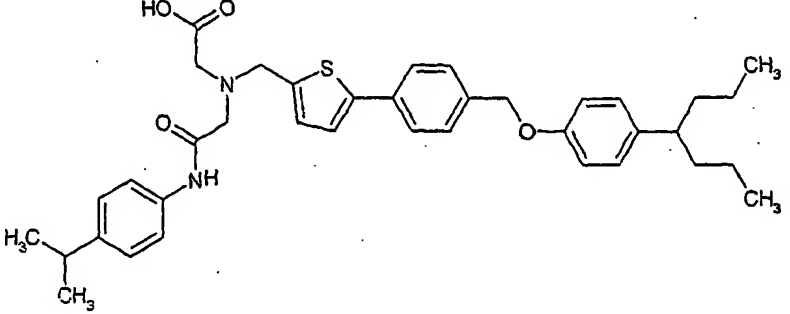
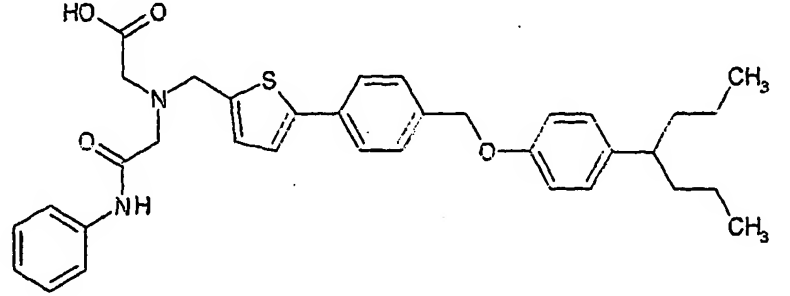
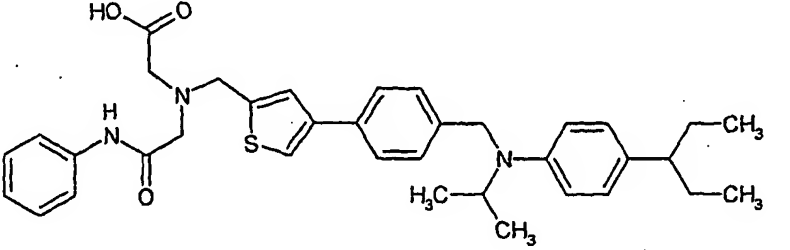
実施例	構造式	融点(°C)
4-8		173 - 175
4-9		172 - 174
4-10		122 - 124
4-11		アモルファス

表 4-4

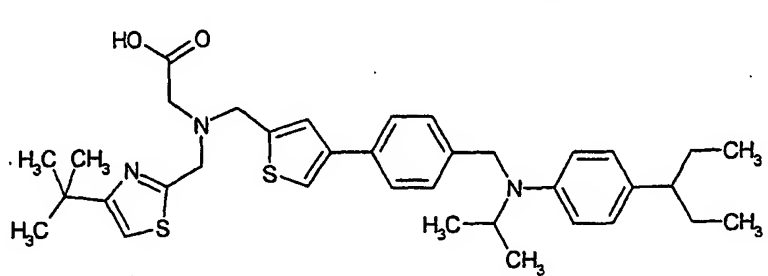
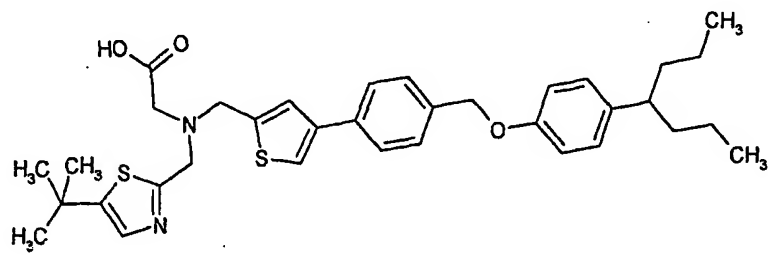
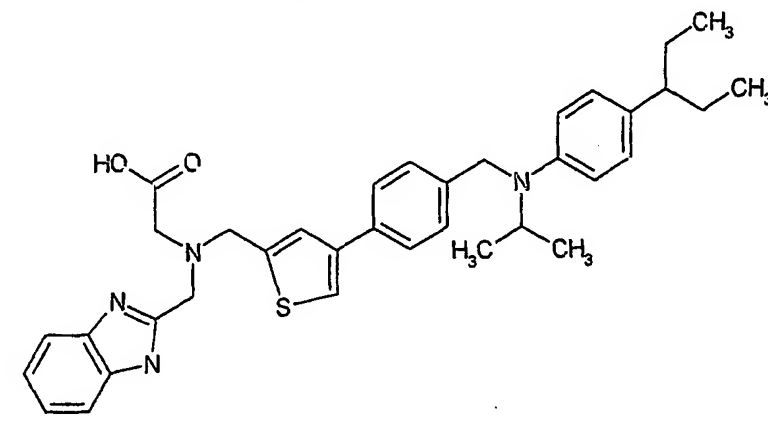
実施例	構造式	融点(°C)
4-12		アモルファス
4-13		アモルファス
4-14		アモルファス

表 4-5

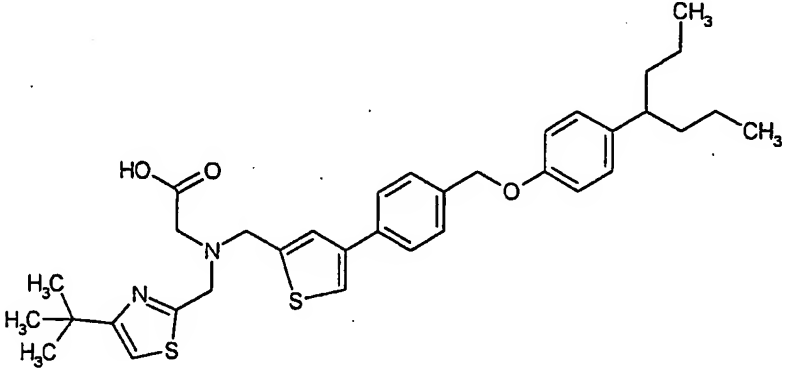
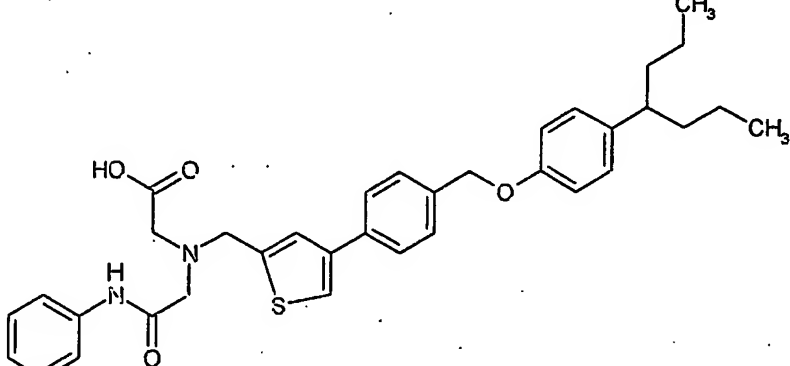
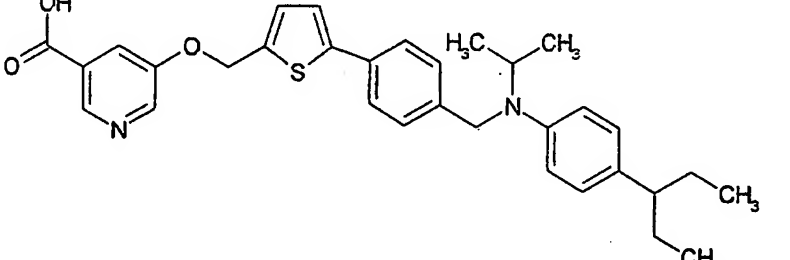
実施例	構造式	融点(°C)
4-15		166
4-16		155
4-17		160 - 164

表 4-6

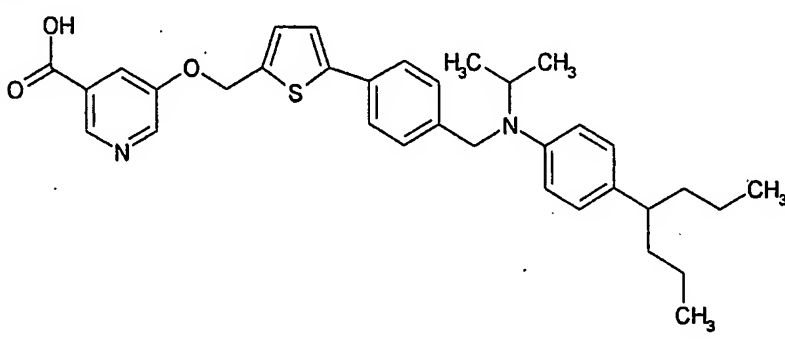
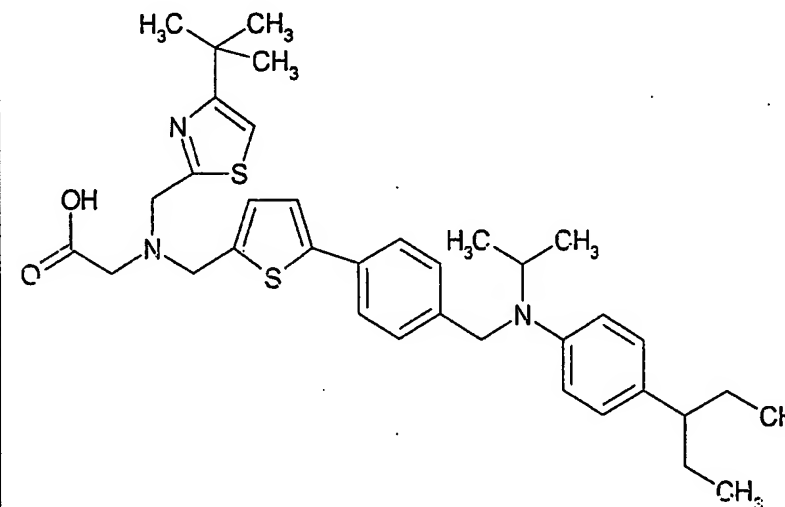
実施例	構造式	融点(°C)
4-18	 <chem>CCCC(C)c1ccc(N(C)Cc2ccc(cc2Sc3cc(OCc4ccncc4C(=O)O)cc3)cc1)cc1</chem>	93 - 98
4-19	 <chem>CCCC(C)c1ccc(N(C)Cc2ccc(cc2Sc3cc(C(C)(C)C)nn3)CCN(C)Cc4ccc(cc4Sc5ccccc5N(C)Cc6ccc(cc6)C(C)CC)cc1</chem>	92 - 98

表 4-7

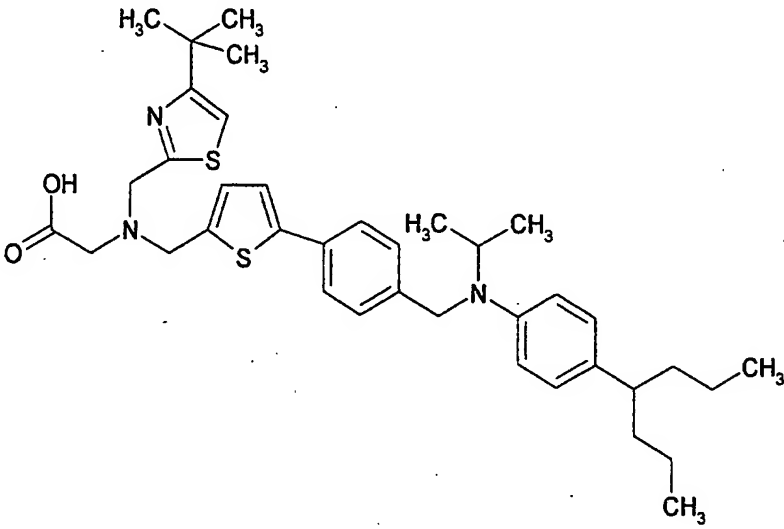
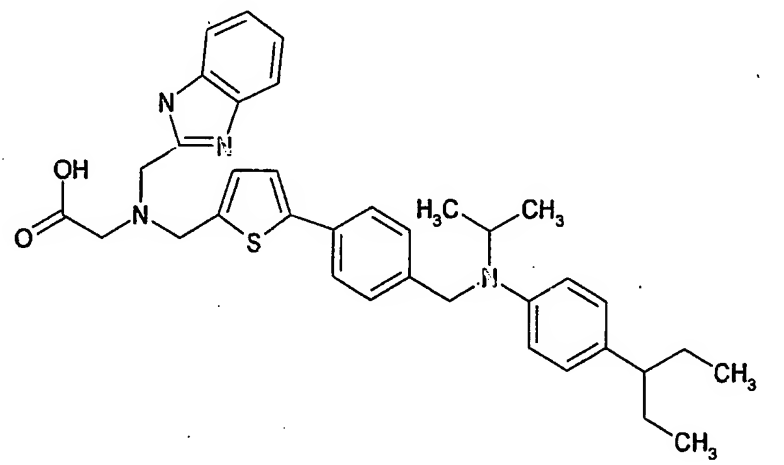
実施例	構造式	融点(°C)
4-20		78 - 82
4-21		142 - 146

表 4-8

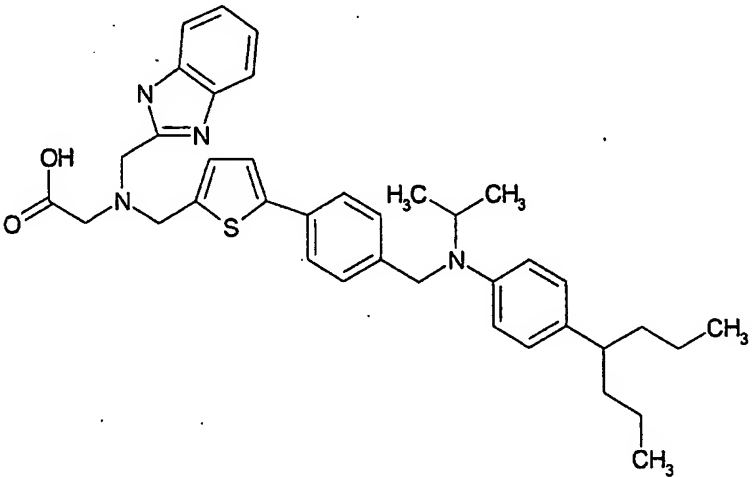
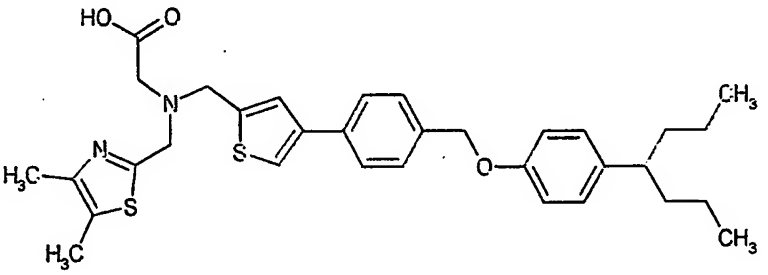
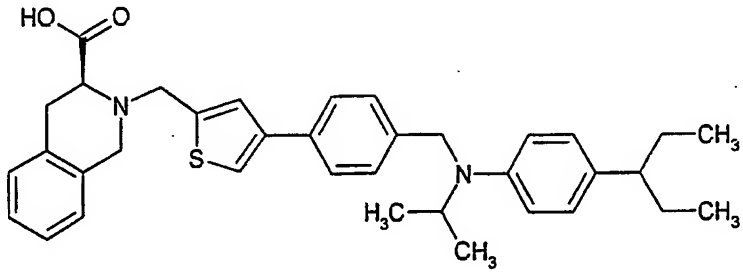
実施例	構造式	融点(°C)
4-22		144 - 150
4-23		アモルファス
4-24		アモルファス

表 4-9

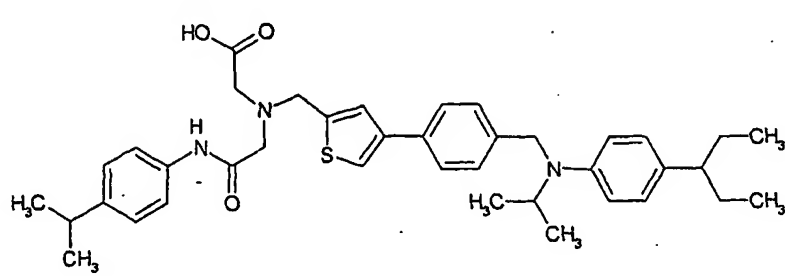
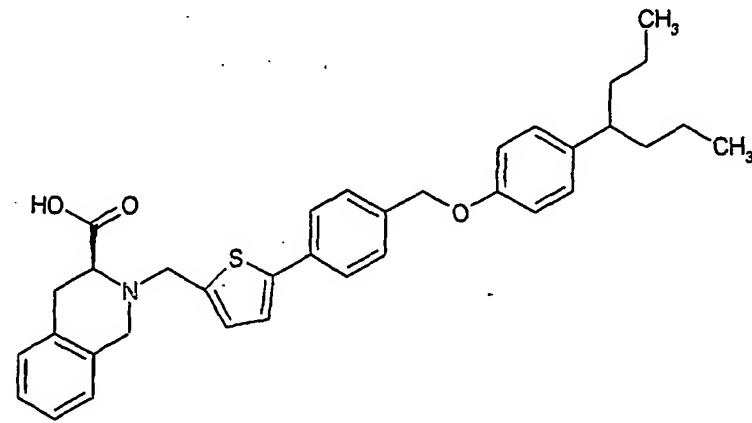
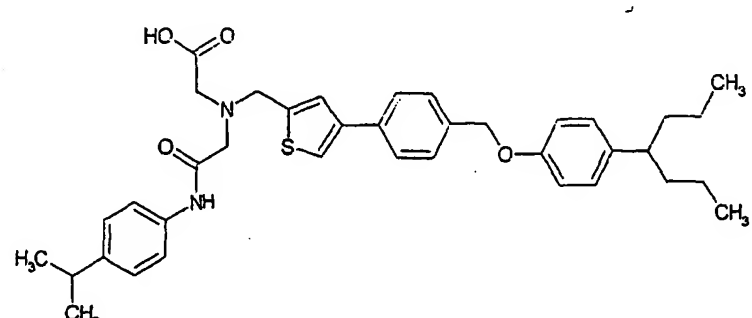
実施例	構造式	融点(°C)
4-25		アモルファス
4-26		アモルファス
4-27		164 - 166

表 4-10

実施例	構造式	融点(°C)
4-28		152
4-29		120.5
4-30		アモルファス
4-31		アモルファス

表 4-11

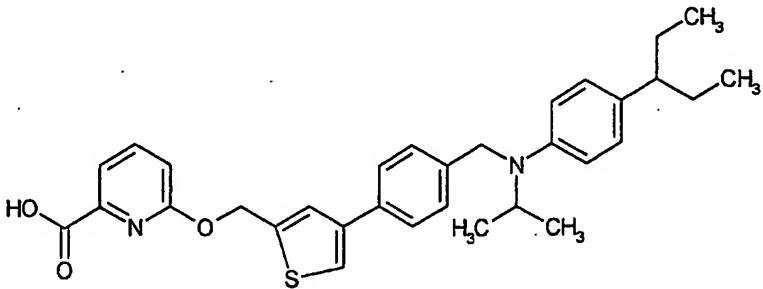
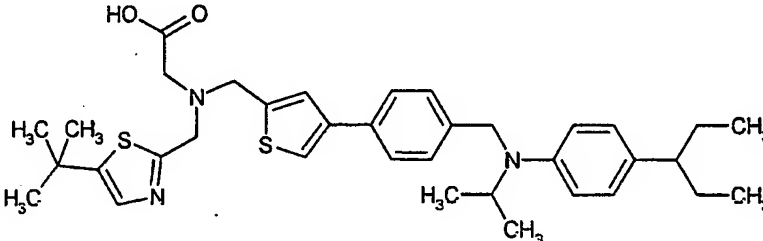
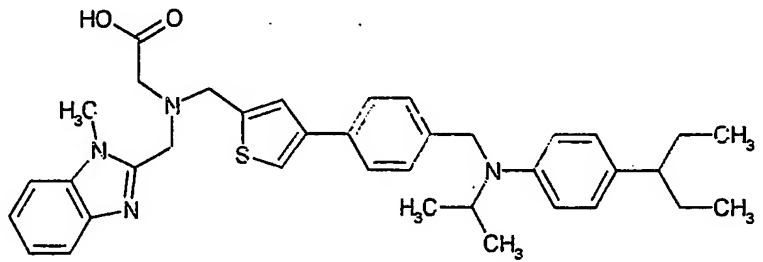
実施例	構造式	融点(°C)
4-32		アモルファス
4-33		アモルファス
4-34		アモルファス

表 4-12

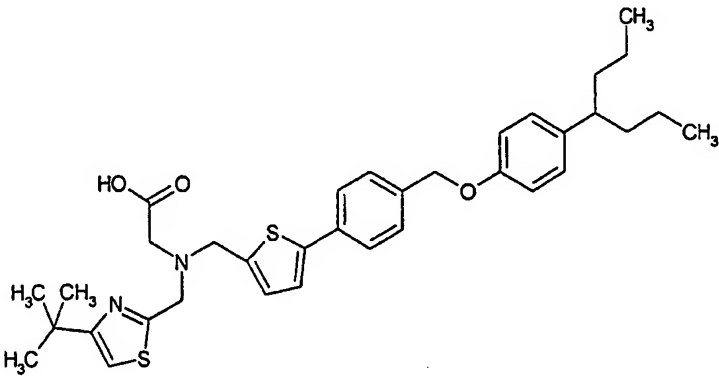
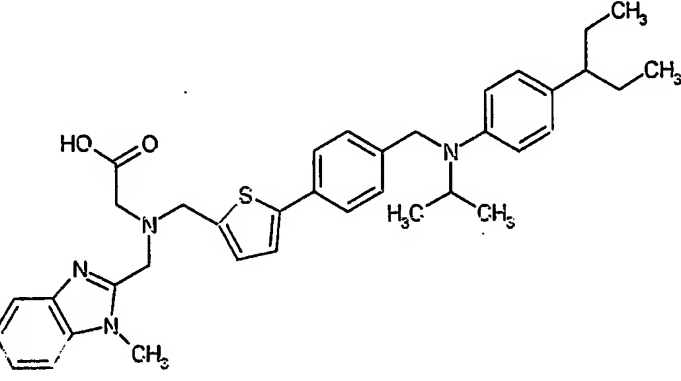
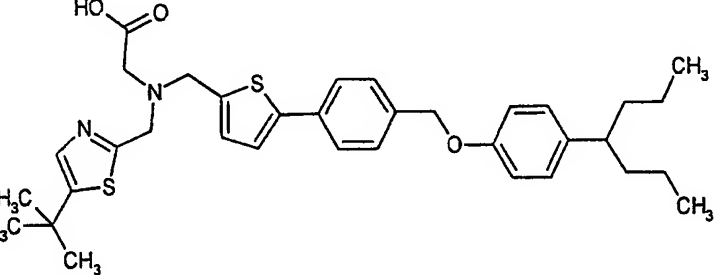
実施例	構造式	融点(°C)
4-35		アモルファス
4-36		アモルファス
4-37		アモルファス

表 4-13

実施例	構造式	融点(°C)
4-38	<p>Na⁺</p>	200 - 203
4-39	<p>Ca²⁺</p>	アモルファス

表 4-14

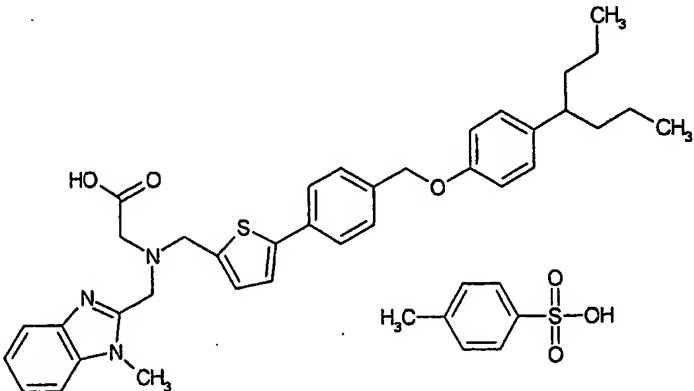
実施例	構造式	融点(°C)
4-40		100- 135

表 4-15

実施例	構造式	融点(°C)
4-41		125 (分解)
4-42		185 - 188
4-43		アモル ファス
4-44		134 - 136

表 4-16

実施例	構造式	融点(°C)
4-45		137 - 139
4-46		147 - 150
4-47		153 - 156
4-48		151 - 155 (分解)

表 4-17

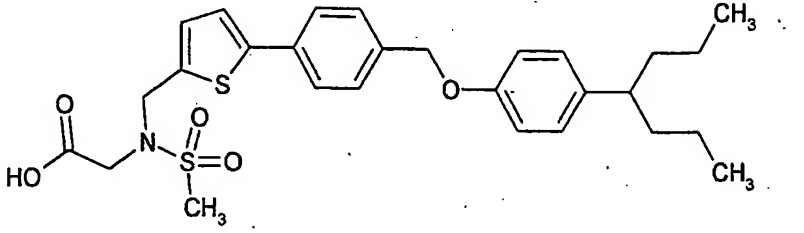
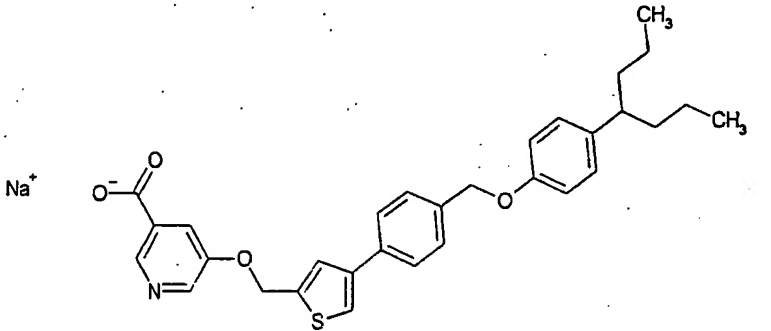
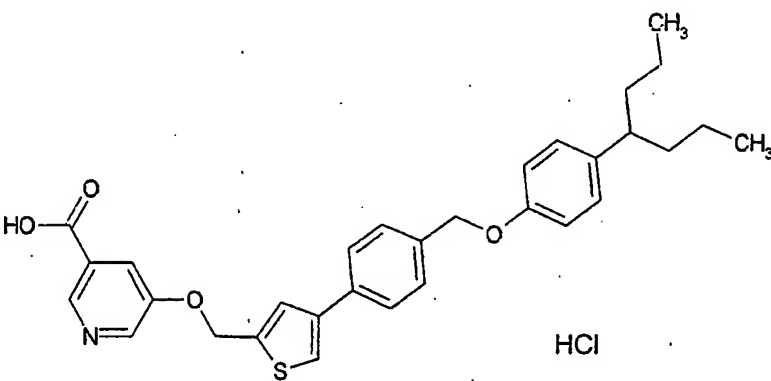
実施例	構造式	融点(°C)
4-49		133.1 - 136.5
4-50		250~
4-51		170 - 173

表 4-18

実施例	構造式	融点(°C)
4-52		アモル ファス
4-53		176 - 178
4-54	<p>HCl</p>	165.7 -166.8
4-55	<p>HO-SO₃H</p>	137.5 - 141.5

表 4-19

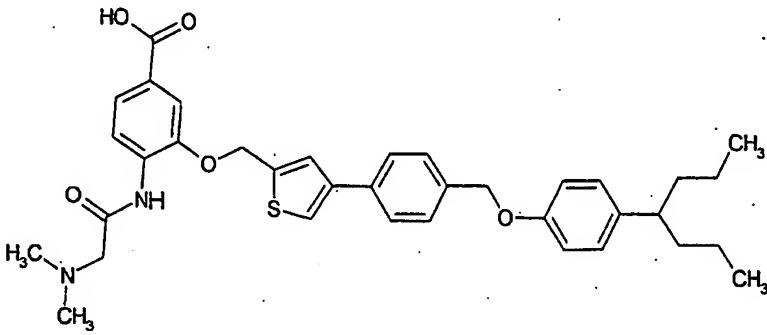
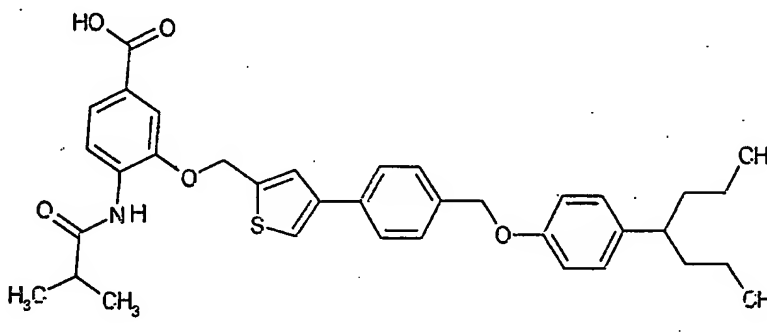
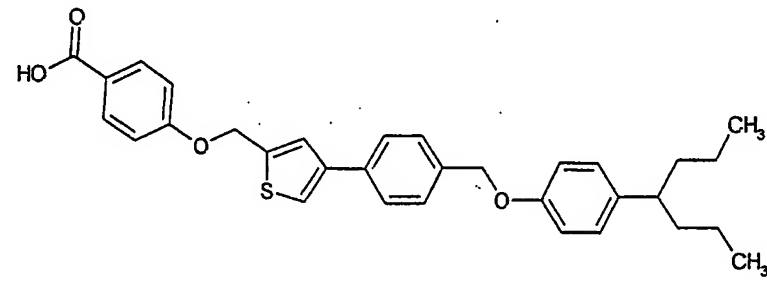
実施例	構造式	融点(°C)
4-56		アモル ファス
4-57		153.7 - 154.9
4-58		194.2 - 195.5

表 4-20

実施例	構造式	融点(°C)
4-59		アモル ファス
4-60		133.9 - 135.1
4-61		156.5 - 165.5
4-62	<p>HCl</p>	227.3 - 233.6

表 4-21

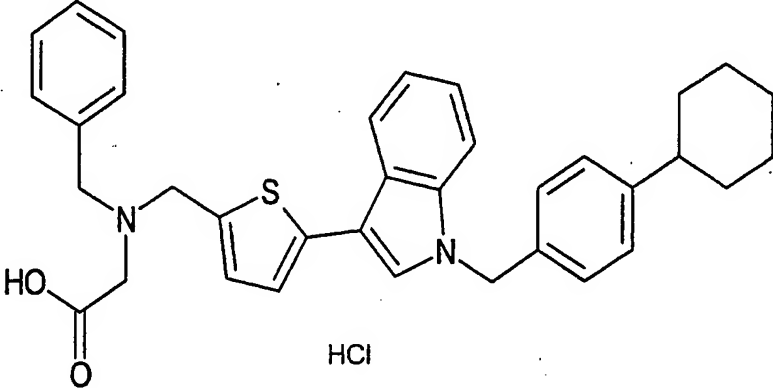
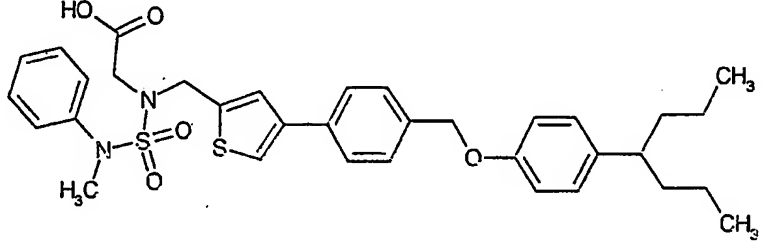
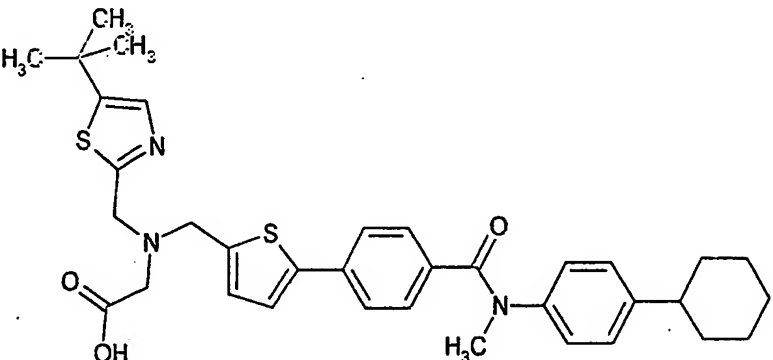
実施例	構造式	融点(°C)
4-63	 <p style="text-align: center;">HCl</p>	161 - 164.3
4-64		139 - 140.2
4-65		アモル ファス

表 4-22

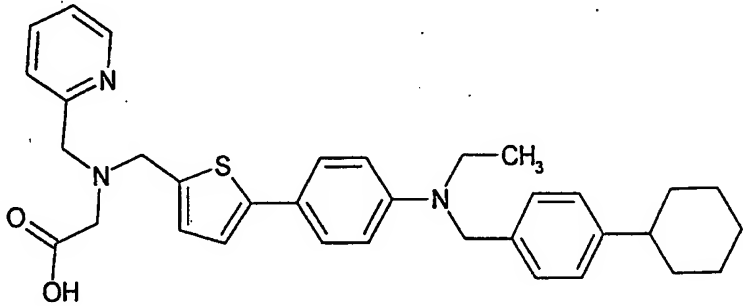
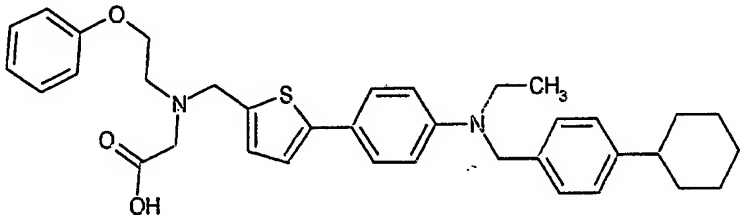
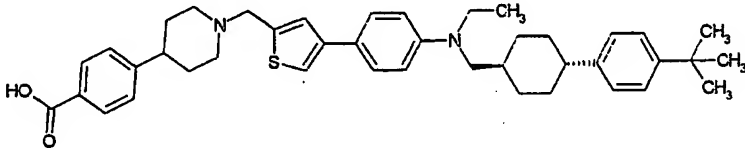
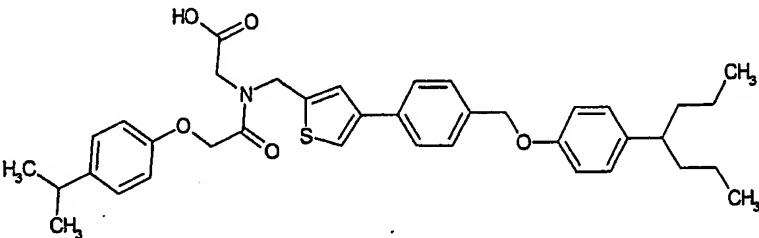
実施例	構造式	融点(°C)
4-66		128 - 131
4-67		141 - 144
4-68		225 - 229 (分解)
4-69		146 - 152

表 4-23

実施例	構造式	融点(°C)
4-70		109 - 111
4-71		176 - 182
4-72		アモル ファス
4-73		69.4 - 78.3

表 4-24

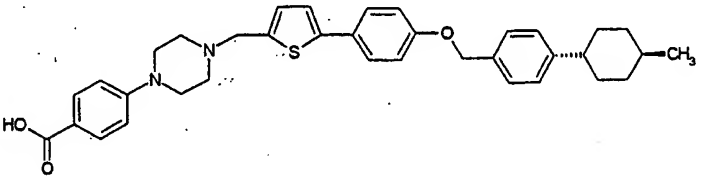
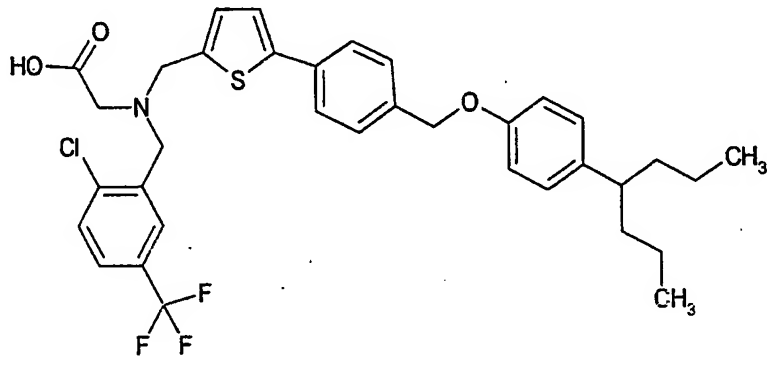
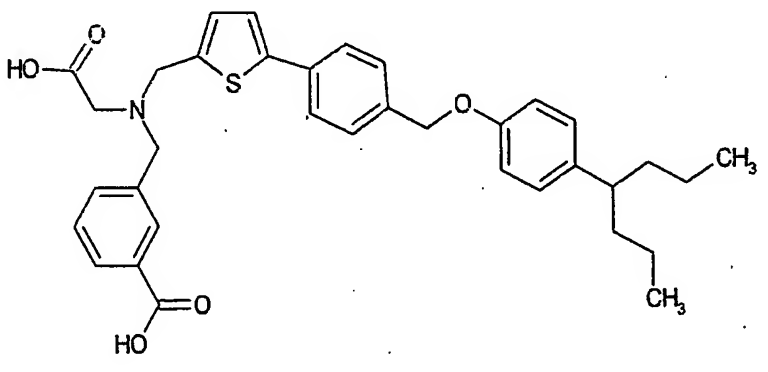
実施例	構造式	融点(°C)
4-74		242.4 - 265.9
4-75		92.6 - 94.7
4-76		202.8 - 206.4

表 4-25

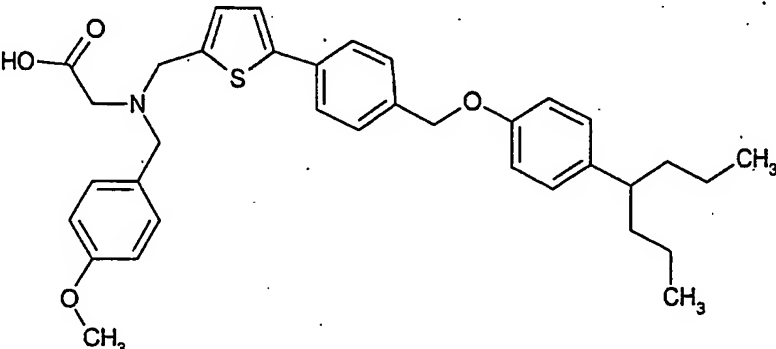
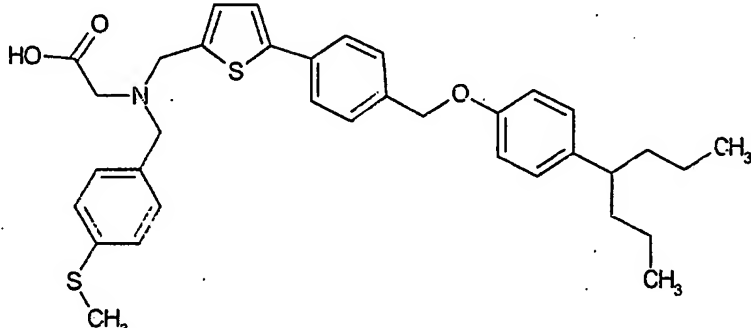
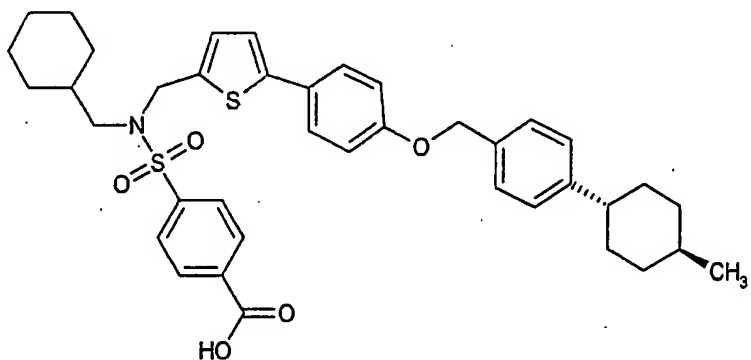
実施例	構造式	融点(°C)
4-77		195.7 - 196.8
4-78		202.7 - 204.3
4-79		234 - 241.8

表 4-26

実施例	構造式	融点(°C)
4-80	 <chem>CC1CCC(CC1)[C@H](c2ccc(OCCOc3ccc(cc3)S4C=CC=C(C4)c5ccc(cc5)C(=O)N(CCN6CCCCC6)C(=O)c7ccc(cc7)C(=O)O)cc2)C</chem>	168 - 169.9
4-81	 <chem>CCc1ccc(cc1)C(CCC)c2ccc(OCCOc3ccc(cc3)S4C=CC=C(C4)c5ccc(cc5)C6(CCN(C6Cc7ccccc7)C(=O)O)cc2c5</chem>	アモル ファス

表 4-27

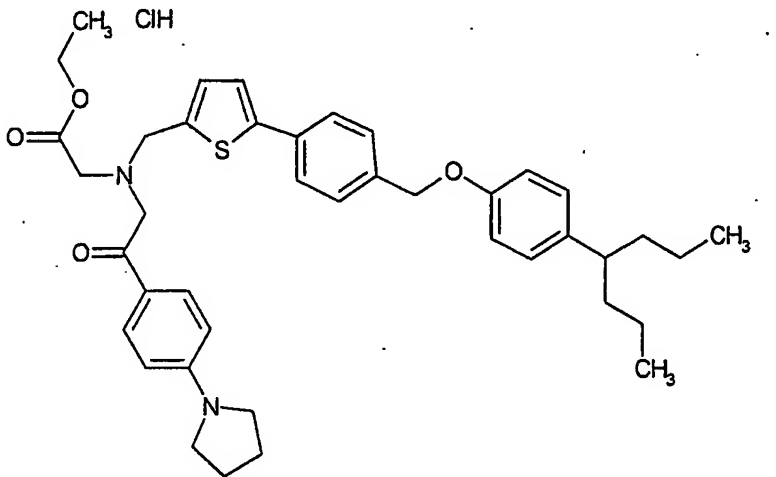
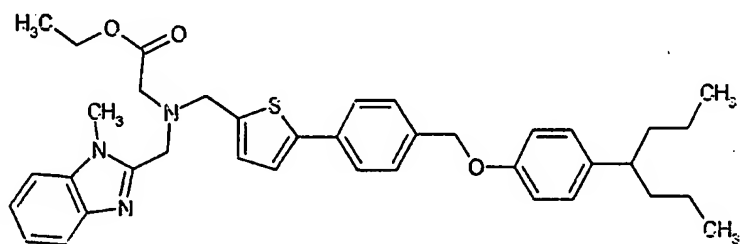
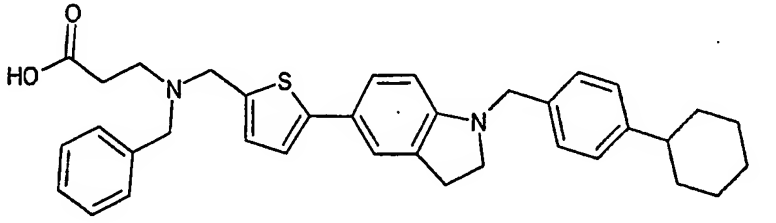
実施例	構造式	融点(°C)
4-82		75.3 - 79.3
4-83		82 - 84
4-84		121 - 128

表 4-28

実施例	構造式	融点(°C)
4-85	<chem>CC(C)(C)CN1C=NC2=CC=CC=C2N1Cc3ccc(cc3)-c4cc5ccccc5s4CCN(CC(=O)O)Cc6ccccc6</chem>	161 - 166
4-86	<chem>CC(C)CC(C)Cc1ccc(Oc2ccc(cc2)Cc3ccc(cc3)-c4cc5ccccc5s4CCN(CC(=O)O)Cc6c[nH]c7ccccc67)c1</chem>	170.5 - 171.9
4-87	<chem>CC(C)CC(C)Cc1ccc(Oc2ccc(cc2)Cc3ccc(cc3)-c4cc5ccccc5s4CCN(CC(=O)O)Cc6cnc7ccccc67)c1</chem>	137.3 - 138.7
4-88	<chem>CC(C)CC(C)Cc1ccc(Oc2ccc(cc2)Cc3ccc(cc3)-c4cc5ccccc5s4CCN(CC(=O)O)Cc6c7ccccc6n7S4</chem>	150.9 - 152.8

表 4-29

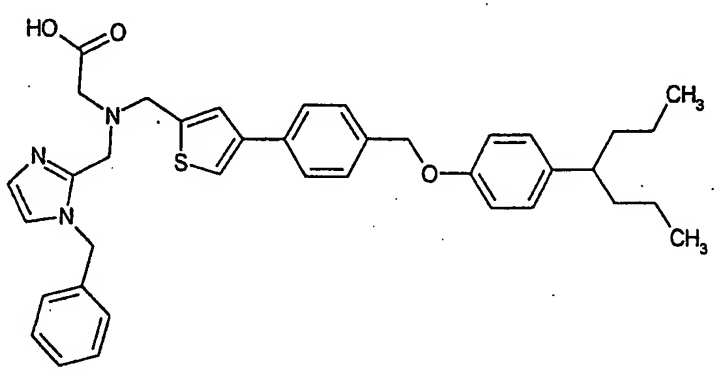
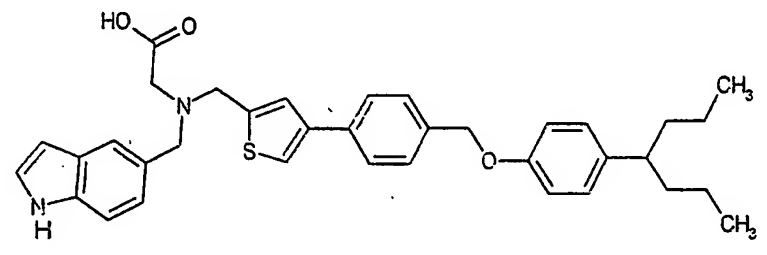
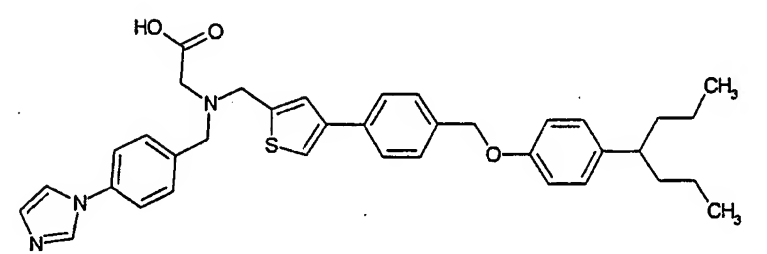
実施例	構造式	融点(°C)
4-89		135.2 - 136
4-90		203.4 - 205.3
4-91		167.5 - 169.9

表 4-30

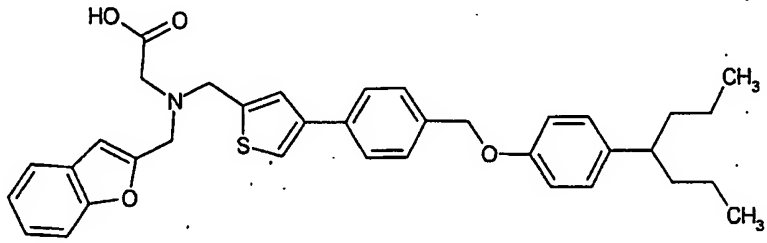
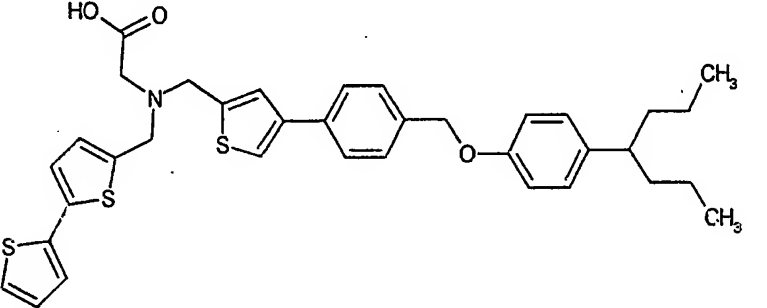
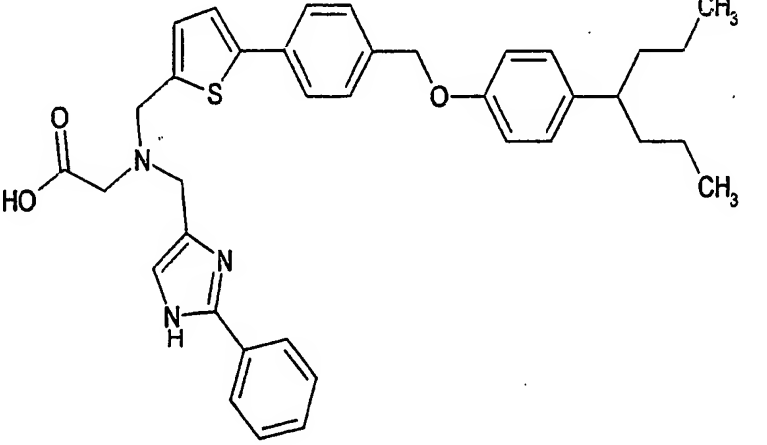
実施例	構造式	融点(°C)
4-92		146.7 - 148.9
4-93		203.8 - 206.2
4-94		131.8 - 137.6

表 4-31

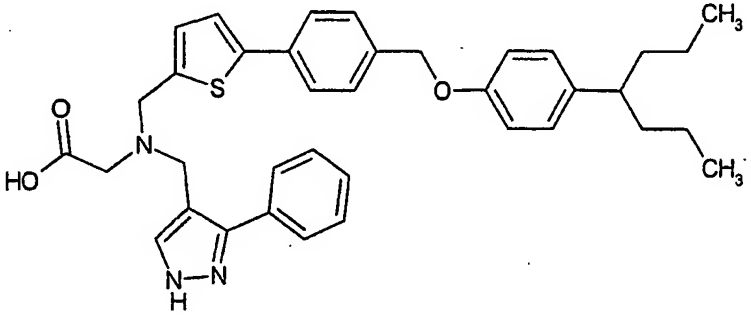
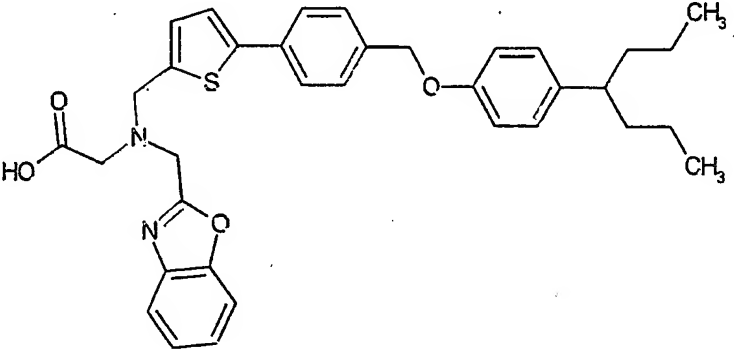
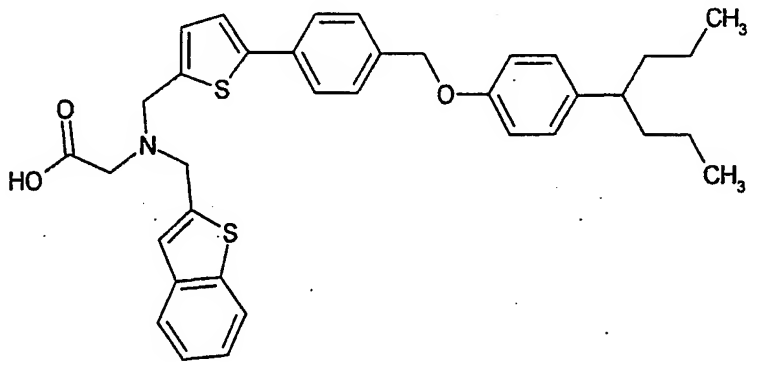
実施例	構造式	融点(°C)
4-95		145.9 - 149.3
4-96		127.4 - 130
4-97		202.3 - 204.4

表 4-32

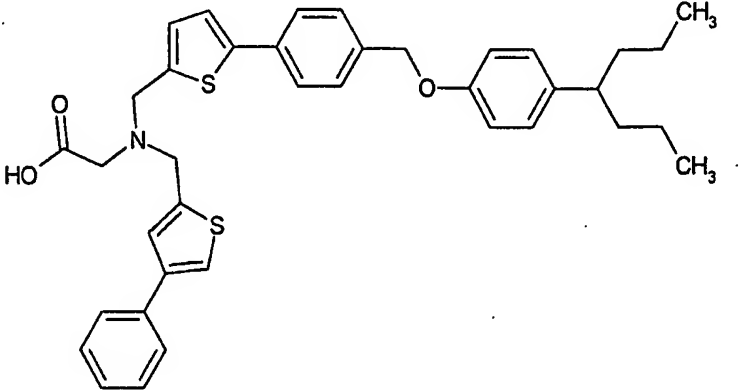
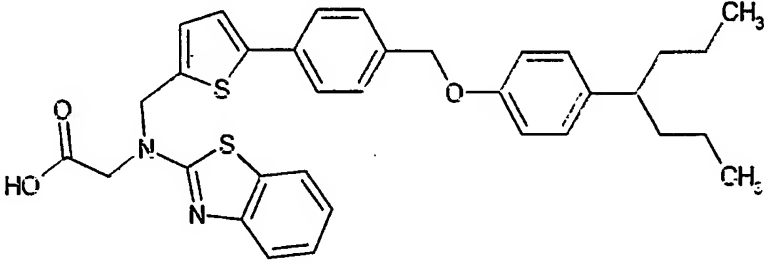
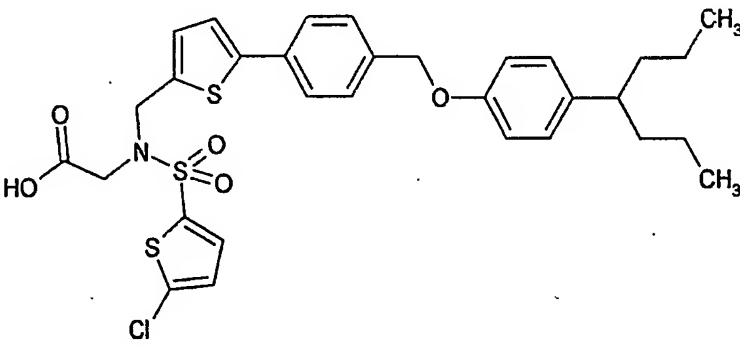
実施例	構造式	融点(°C)
4-98		181.4 - 184.5
4-99		104.4 - 107.2
4-100		151.2 - 154.4

表 4-33

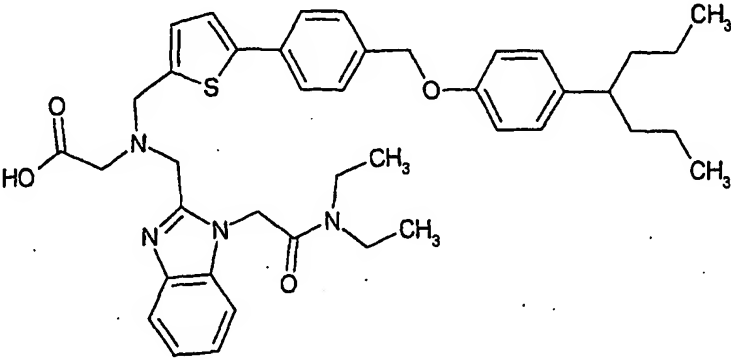
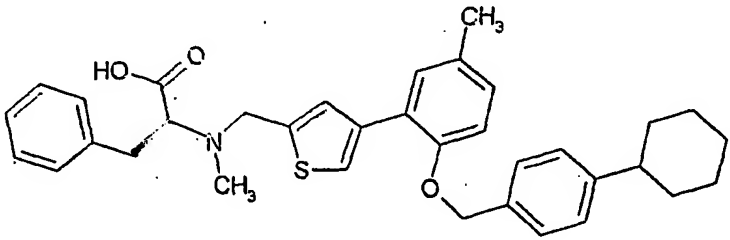
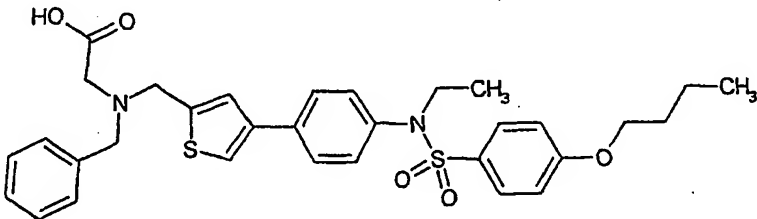
実施例	構造式	融点(°C)
4-101		194.8 - 197
4-102		117 - 123.1
4-103		120.7 - 123.3

表 4-34

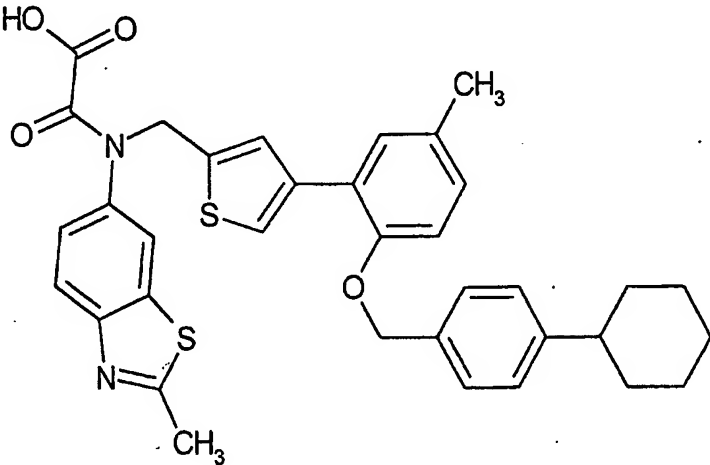
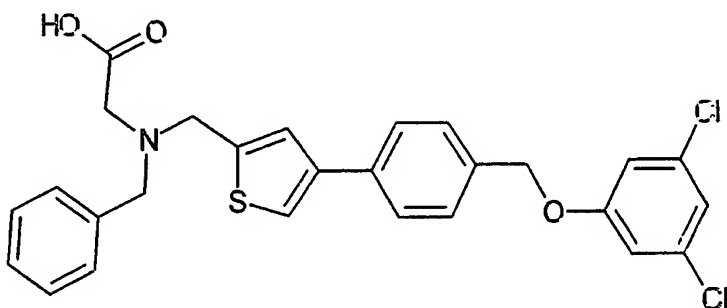
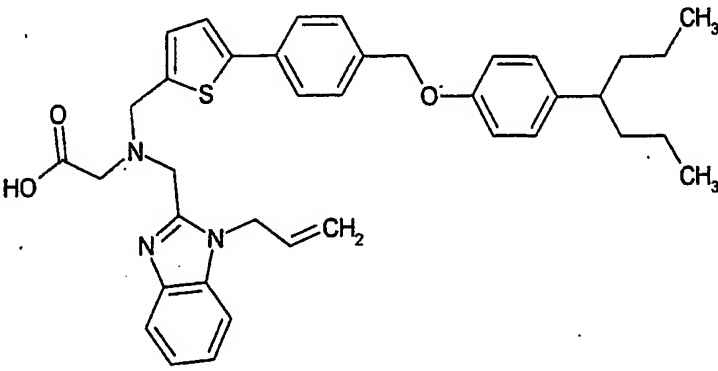
実施例	構造式	融点(°C)
4-104		115.9 - 121.1
4-105		202.3 - 204.2
4-106		141.2 - 144.1

表 4-35

実施例	構造式	融点(°C)
4-107		116 - 117.6

以下に製剤例を挙げるが、本発明はこれに限定されるものではない。

製剤例

	(a) 実施例 1 の化合物	1 0 g
	(b) 乳糖	5 0 g
5	(c) トウモロコシデンプン	1 5 g
	(d) カルボキシメチルセルロースナトリウム	4 4 g
	(e) ステアリン酸マグネシウム	1 g

(a)、(b)、(c) の全量及び (d) の 3 0 g を水で練合し、真空乾燥後、製粒を行う。この製粒末に 1 4 g の (d) 及び 1 g の (e) を混合し、打錠機で錠剤とすることにより、1 錠あたり 1 0 m g の (a) を含有する錠剤 1 0 0 0 個を製造する。

次に本発明の蛋白質チロシンホスファターゼ 1 B 阻害作用について行った試験の結果を示す。

15 (試験例)

試験例 1 (蛋白質チロシンホスファターゼ 1 B 阻害作用)

・アッセイ緩衝液の調製：

5 0 m M T r i s - H C l 緩衝液 (p H 7 . 5)、5 0 m M N a C l 及び 3 m M ジチオトレイトール (D T T) を調製した。

20 ・検体の調製：

最終ジメチルスルホキシド (DMSO) 濃度が 1 % 以下になるようにそれぞれ 0 . 1、0 . 3、1、3 及び 1 0 μ M の試験化合物の 1 0 m M DMSO 溶液を上記のアッセイ緩衝液で希釈した。なお、コントロールとしてはアッセイ緩衝液を使用した。

25 ・基質の調製：

インスリンレセプターの配列 1 1 4 2 から 1 1 5 3 までの 1 2 アミノ酸で 3 箇所のチロシンをリン酸化した合成ペプチドを上記のアッセイ緩衝液で希釈し、8 0 μ M に調製した。

・酵素の調製：

30 U B I 社製の組換え型ヒト蛋白質チロシンホスファターゼ 1 B を上記のアッセイ緩衝液で希釈した (1 . 2 n g / 2 5 μ l)。

(評価方法)

96穴プレートに、上記の通り調製した検体 $10\mu\text{l}$ 及び基質 $25\mu\text{l}$ を順次添加し、上記の通り調製した酵素 $25\mu\text{l}$ を添加し、混合した。室温で60分間インキュベートした後、リン発色剤であるマラカイトグリーン (Bio mol 社) $120\mu\text{l}$ を加え、更に室温で20分間イン
5 キュベートし、発色させた。これをプレートリーダーで 650nm での吸光度を測定し、試験化合物の蛋白質チロシンホスファターゼ1B阻害作用を評価した。その結果を表5乃至6に示した。

また、実施例1-1、1-27、1-48、1-65、1-66、1-68、1-71、1-77、1-78、1-80、1-86、1-8
10 8、1-89、1-94、1-97、1-105、1-109、1-110、1-111、1-119、1-120、1-126、1-130、1-132、1-138、1-139、1-140、1-141、1-146、1-149、1-153、1-155、1-156、1-160、1-161、1-162、3-1、3-117、3-120、3-
15 124、4-1、4-2、4-6、4-8、4-9、4-17、4-18、4-19、4-21、4-27、4-30、4-31、4-34、4-36及び4-37の化合物を対象として、それらの試験化合物のT細胞蛋白質チロシンホスファターゼ阻害作用を評価し、前記記載の蛋白質チロシンホスファターゼ1Bに対する IC_{50} はT細胞蛋白質チロシンホスファ
20 ーゼに対する IC_{50} よりも $1/60$ 以下の低値であった。

試験例2 (血糖低下作用)

飽食時血糖値により群分けした6乃至9週齢の雄o b / o b マウスに、試験化合物の0.5%メチルセルロース懸濁液を経口投与した。なお、
25 コントロール群には0.5%メチルセルロース溶液のみを投与した。

採血は、絶食条件下で行った。すなわち、当該絶食条件は、上記試験化合物投与と同時に餌を抜くことによって開始し、投与3時間後、麻醉下において眼窩静脈より採血した。このようにして採取された血液を遠心分離した後、得られた血漿からヘキソキナーゼ法 (グルコース測定キ
30 ャット) を用いて血糖値を測定した。評価は、コントロール群に対する試験化合物投与群の血糖値の低下率を%で示した。その結果を表5乃至9に示した。

表 5

実施例	PTP1B 阻害作用 (IC ₅₀ ; μ M)	血糖低下率 (%)	
		用量 (mg/kg)	3 時間後
1-1	0.28	1	45
1-15	0.13	1	35
1-19	0.10	1	35
1-25	0.13	1	25
1-37	0.14	3	26
1-39	0.19	1	32
1-44	0.22	1	20
1-45	0.066	1	32
1-48	0.23	1	46
1-50	0.14	---	
1-53	0.24	---	
1-78	0.18	3	24
1-141	0.35	---	
3-9	0.17	1	18
3-10	0.20	1	18
3-14	0.38	---	
3-15	0.27	1	25
3-21	0.45	1	27
3-25	0.14	1	20
3-26	0.11	---	
3-29	0.41	3	41
3-32	0.18	1	14
3-34	0.16	---	

表 6

実施例	PTP1B 阻害作用 (IC50; μ M)	血糖低下率 (%)	
		用量 (mg/kg)	3 時間後
3-35	0.073	---	
3-36	0.10	3	52
3-52	0.54	1	28
3-53	0.28	1	20
3-58	0.39	1	23
3-64	0.21	1	13
3-67	0.23	3	20
3-69	0.16	---	
3-70	0.16	---	
3-71	0.095	---	
3-73	0.20	1	14
3-76	0.48	1	33
3-86	0.20	1	16
3-87	0.21	---	
3-92	0.18	1	26
3-98	0.16	3	31
3-100	0.15	3	20
3-108	0.16	1	29
4-1	0.15	---	
4-6	0.092	---	
4-9	0.12	---	
4-30	0.17	---	
4-35	0.087	---	

表 7

実施例	PTP1B 阻害作用 (IC ₅₀ : μ M)	血糖低下率 (%)	
		用量 (mg/kg)	3 時間後
1-155	0.37	----	
1-156	0.19	----	
1-157	0.17	----	
1-158	0.29	----	
1-160	0.31	----	
1-161	0.18	----	
1-162	0.21	----	
1-166	0.31	----	
1-167	0.41	----	
1-172	0.28	----	
1-178	0.44	----	
1-181	0.20	----	
1-182	0.19	----	
4-42	0.17	----	
4-43	0.16	----	
4-44	0.12	----	
4-45	0.27	----	
4-52	0.15	----	
4-53	0.07	----	
4-54	0.14	----	
4-55	0.17	----	
4-56	0.20	----	
4-57	0.17	----	

表 8

実施例	PTP1B 阻害作用 (IC50; μ M)	血糖低下率 (%)	
		用量 (mg/kg)	3 時間後
4-58	0.19	---	
4-59	0.18	---	
4-60	<0.1	---	
4-61	0.25	---	
4-62	0.45	---	
4-63	0.42	---	
4-64	0.24	---	
4-66	0.45	---	
4-67	0.23	---	
4-68	<0.1	---	
4-69	0.15	---	
4-70	0.17	---	
4-72	0.29	---	
4-73	0.19	---	
4-74	0.11	---	
4-75	<0.1	---	
4-77	0.40	---	
4-78	0.38	---	
4-79	<0.1	---	
4-80	<0.1	---	
4-81	<0.1	---	
4-82	0.48	---	
4-84	0.27	---	

表 9

実施例	PTP1B 阻害作用 (IC50; μ M)	血糖低下率 (%)	
		用量 (mg/kg)	3 時間後
4-87	0.12	---	
4-88	<0.1	---	
4-89	0.49	---	
4-90	0.16	---	
4-91	0.17	---	
4-92	<0.1	---	
4-93	<0.1	---	
4-94	0.12	---	
4-95	0.28	---	
4-96	0.12	---	
4-97	0.11	---	
4-98	<0.1	---	
4-99	<0.1	---	
4-100	<0.1	---	
4-101	0.10	---	
4-102	0.37	---	
4-104	0.20	---	
4-106	0.16	---	
4-107	<0.1	---	

試験例 3 (血糖低下作用に及ぼすインスリンとの併用の効果)

7 週齢、雄性の SD ラットに、1 日 1 回、8 日間、試験化合物 (付
 5 注: 実施例 3-40 (30mg/kg)) の 0.5% メチルセルロース懸濁液
 (試験化合物及びインスリン併用群) 又は 0.5% メチルセルロース溶
 液のみ (インスリン投与群) を経口投与し、その 3 時間後にインスリン
 0.6 U/kg を皮下より投与した。

採血は、投与開始日、8 日目のインスリン投与前及びその 1 時間後、
 10 尾静脈より行った。なお、採血にあたっては、インスリン投与の後絶食
 とした。このようにして採取された血液を遠心分離した後、得られた血
 漿からヘキソキナーゼ法 (グルコース測定キット) を用いて血糖値を測
 定した。評価は、試験化合物及びインスリン併用、インスリン投与各群
 のインスリン投与前に対する 1 時間後の血糖値の低下率を % で示した。
 15 その結果を表 10 に示した。

表 1 0

	試験化合物 用量 (mg/kg)	血糖低下率 (%)	
		投与開始日	8 日目
インスリン投与群	-----	29	17
試験化合物及び インスリン併用群 (実施例 3-40)	30	43	36

試験例 4 (血糖低下作用に及ぼすグリベンクラミドとの併用の効果)

- 5 飽食血糖値により群分けした 10 週齢雌 ob/ob マウスに、試験化合物 {付注：実施例 4-2 (1mg/kg)} の 0.5%メチルセルロース懸濁液 (試験化合物投与群)、グリベンクラミド 3 mg / kg の 0.5%メチルセルロース懸濁液 (グリベンクラミド投与群)、試験化合物の 0.5%メチルセルロース懸濁液とグリベンクラミド 3 mg / kg の 0.5%メチルセルロース懸濁液とを同時に両方 (試験化合物及びグリベンクラミド併用群) 又は
- 10 0.5%メチルセルロース溶液のみ (コントロール群) を経口投与した。

- 採血は、絶食条件下で行った。すなわち、当該絶食条件は、上記試験化合物投与と同時に餌を抜くことにより開始し、投与 3 および 5 時間後、
- 15 麻酔下において眼窩静脈より採血した。このように採取された血液を遠心分離した後、得られた血漿からヘキソキナーゼ法 (グルコースキット) を用いて血糖値を測定した。評価は、コントロール群に対するそれ以外の各群の血糖値の降下率を % で示した。その結果を表 1 1 に示した。

表 1 1

	試験化合物 用量 (mg/kg)	血糖低下率 (%)	
		3 時間後	5 時間後
グリベンクラミド投与群	-----	44	40
試験化合物投与群 (実施例 4-2)	1	48	20
試験化合物及び グリベンクラミド併用群 (実施例 4-2)	1	64	60

試験例 5 (血糖低下作用に及ぼすトルブタミドとの併用の効果)

飽食血糖値により群分けした 10 週齢雄 db/db マウスに、試験化合物 {付注：実施例 4-5 (5mg/kg)} の 0.5%メチルセルロース懸濁液 (試験化合物投与群)、トルブタミド 30 mg/kg の 0.5%メチルセルロース懸濁液 (トルブタミド投与群)、試験化合物の 0.5%メチルセルロース懸濁液とトルブタミド 30 mg/kg の 0.5%メチルセルロース懸濁液とを同時に両方 (試験化合物及びトルブタミド併用群) 又は 0.5%メチルセルロース溶液のみ (コントロール群) を経口投与した。

採血は、絶食条件下で行った。すなわち、当該絶食条件は、上記試験化合物投与と同時に餌を抜くことにより開始し、投与 5 時間後、麻酔下において眼窩静脈より採血した。このように採取された血液を遠心分離した後、得られた血漿からヘキソキナーゼ法 (グルコースキット) を用いて血糖値を測定した。評価は、コントロール群に対するそれ以外の各群の血糖値の低下率を % で示した。その結果を表 12 に示した。

15

表 12

	試験化合物 用量 (mg/kg)	血糖低下率 (%)
		5 時間後
トルブタミド投与群	-----	26
試験化合物投与群 (実施例 4-5)	5	26
試験化合物及び トルブタミド併用群 (実施例 4-5)	5	30

試験例 6 (血糖低下作用に及ぼすナテグリニドとの併用の効果)

飽食血糖値により群分けした 10 週齢雄 db/db マウスに、試験化合物 {付注：実施例 4-5 (5mg/kg)} の 0.5%メチルセルロース懸濁液 (試験化合物投与群)、ナテグリニド 30 mg/kg の 0.5%メチルセルロース懸濁液 (ナテグリニド投与群)、試験化合物の 0.5%メチルセルロース懸濁液とナテグリニド 30 mg/kg の 0.5%メチルセルロース懸濁液とを同時に両方 (試験化合物及びナテグリニド併用群) 又は 0.5%メチルセルロース溶液のみ (コントロール群) を経口投与した。

25

- 採血は、絶食条件下で行った。すなわち、当該絶食条件は、上記試験化合物投与と同時に餌を抜くことにより開始し、投与2時間後、麻酔下において眼窩静脈より採血した。このように採取された血液を遠心分離した後、得られた血漿からヘキソキナーゼ法(グルコースキット)を用いて血糖値を測定した。評価は、コントロール群に対するそれ以外の各群の血糖値の降下率を%で示した。その結果を表13に示した。

表 1 3

	試験化合物 用量 (mg/kg)	血糖低下率 (%)
		2 時間後
ナテグリニド投与群	-----	5
試験化合物投与群 (実施例 4-5)	5	11
試験化合物及び ナテグリニド併用群 (実施例 4-5)	5	19

10 試験例 7 (血糖低下作用に及ぼす塩酸メトホルミンとの併用の効果)

- 飽食血糖値により群分けした 10 週齢雌 ob/ob マウスに、試験化合物 {付注：実施例 4-2 (1mg/kg)} の 0.5%メチルセルロース懸濁液 (試験化合物投与群)、塩酸メトホルミン 30 mg/kg の 0.5%メチルセルロース懸濁液 (メトホルミン投与群)、試験化合物の 0.5%メチルセルロース懸濁液と塩酸メトホルミン 30 mg/kg の 0.5%メチルセルロース懸濁液とを同時に両方 (試験化合物及びメトホルミン併用群) 又は 0.5%メチルセルロース溶液のみ (コントロール群) を経口投与した。

- 採血は、絶食条件下で行った。すなわち、当該絶食条件は、上記試験化合物投与の 3 時間前に餌を抜くことにより開始し、投与 3 および 5 時間後、麻酔下にて眼窩静脈より採血した。このように採取された血液を遠心分離した後、得られた血漿からヘキソキナーゼ法(グルコースキット)を用いて血糖値を測定した。評価は、コントロール群に対するそれ以外の各群の血糖値の降下率を%で示した。その結果を表 1 4 に示した。

表 1 4

	試験化合物 用量 (mg/kg)	血糖低下率 (%)	
		3 時間後	5 時間後
メトホルミン投与群	-----	17	39
試験化合物投与群 (実施例 4-2)	1	19	20
試験化合物及び メトホルミン併用群 (実施例 4-2)	1	40	51

試験例 8 (血糖低下作用に及ぼすボグリボースとの併用の効果)

飽食血糖値により群分けした 9 週齢雌 ob/ob マウスに試験化合物 {付
 5 注: 実施例 4-2 (1mg/kg)} の 0.5%メチルセルロース懸濁液 (試験化
 合物投与群)、ボグリボース 0.3 mg/kg の 0.5%メチルセルロース
 懸濁液 (ボグリボース投与群)、試験化合物の 0.5%メチルセルロース懸
 濁液とボグリボース 0.3 mg/kg の 0.5%メチルセルロース懸濁液と
 を同時に両方 (試験化合物及びボグリボース併用群) 又は 0.5%メチルセ
 10 ルロース溶液のみ (コントロール群) を経口投与し、その 1 時間後に
 2g/5mL/kg のスクロースを負荷した。

採血は、絶食条件下で行った。すなわち、当該絶食条件は、スクロー
 ー負荷と同時に餌を抜くことにより開始し、負荷 1 および 2 時間後、麻
 酔下において眼窩静脈より採血した。このように採取された血液を遠心
 15 分離した後、得られた血漿からヘキソキナーゼ法 (グルコースキット) を
 用いて血糖値を測定した。評価は、コントロール群に対するそれ以外の
 各群の血糖値の低下率を % で示した。その結果を表 1 5 に示した。

表 1 5

	試験化合物 用量 (mg/kg)	血糖低下率 (%)	
		1 時間後	2 時間後
ボグリボース投与群	-----	35	38
試験化合物投与群 (実施例 4-2)	1	32	40
試験化合物及び ボグリボース併用群 (実施例 4-2)	1	49	54

試験例 9 (血糖低下作用に及ぼす塩酸ピオグリタゾンとの併用の効果)

飽食血糖値により群分けした 8 週齢雄 db/db マウスに、試験化合物
 5 {付注：実施例 4-5 (10mg/kg)} の 0.5%メチルセルロース懸濁液 (試験化合物投与群)、塩酸ピオグリタゾン 3 mg/kg の 0.5%メチルセルロース懸濁液 (ピオグリタゾン投与群)、試験化合物の 0.5%メチルセルロース懸濁液と塩酸ピオグリタゾン 3 mg/kg の 0.5%メチルセルロース懸濁液とを同時に両方 (試験化合物及びピオグリタゾン併用群) 又は
 10 0.5%メチルセルロース溶液のみ (コントロール群) を 1 日 1 回、3 日間経口投与した。

採血は、絶食条件下で行った。すなわち、当該絶食条件は、上記試験化合物投与と同時に餌を抜くことにより開始し、投与初日および 3 日目の投与 3 時間後、麻酔下において眼窩静脈より採血した。このように採
 15 取された血液を遠心分離した後、得られた血漿からヘキソキナーゼ法 (グルコースキット) を用いて血糖値を測定した。評価は、コントロール群に対するそれ以外の各群の血糖値の低下率を % で示した。その結果を表 1 6 に示した。

表 1 6

	試験化合物 用量 (mg/kg)	血糖低下率 (%)	
		投与開始日	3日目
ピオグリタゾン投与群	-----	11	44
試験化合物投与群 (実施例 4-5)	10	24	32
試験化合物及び ピオグリタゾン併用群 (実施例 4-5)	10	30	48

実施例化合物のNMRデータを以下の表に示す。

表 17-1

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
1-1	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.69 (t, J = 7.3 Hz, 6H), 1.16 (d, J = 6.5 Hz, 6H), 1.48-1.31 (m, 2H), 1.64-1.48 (m, 2H), 2.19-2.06 (m, 1H), 4.23 (quint, J = 6.6 Hz, 1H), 5.67 (s, 2H), 6.62 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.89 (d, J = 8.6 Hz, 2H), 7.36 (d, J = 8.2 Hz, 2H), 7.90 (d, J = 8.2 Hz, 2H), 7.99 (dd, J = 3.0, 1.5 Hz, 1H), 8.11 (s, 1H), 8.64 (d, J = 2.9 Hz, 1H), 8.72 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 13.43 (br s, 1H).
1-2	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.68 (t, J = 7.4 Hz, 6 H), 1.14 (d, J = 8.0 Hz, 6 H), 1.32-1.46 (m, 2 H), 1.50-1.62 (m, 2 H), 2.08-2.17 (m, 1 H), 4.23 (quint, J = 6.6 Hz, 1 H), 4.37 (s, 2 H), 5.57 (s, 2 H), 6.62 (d, J = 8.8 Hz, 2 H), 6.88 (d, J = 8.8 Hz, 2 H), 7.17 (d, J = 9.2 Hz, 2 H), 7.36 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 7.89 (d, J = 8.8 Hz, 2 H), 7.91 (d, J = 9.0 Hz, 2 H), 8.09 (s, 1 H), 12.64 (br s, 1 H).
1-3	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.68(t, J=7.2Hz, 6H), 1.16(d, J=6.4Hz, 2H), 1.35-1.45(m, 2H), 1.50-1.60(m, 2H), 2.10-2.15(m, 1H), 4.20-4.25(m, 1H), 4.37(s, 2H), 5.75(s, 2H), 6.61(d, J=10.2Hz, 2H), 6.87(d, J=11.6Hz, 2H), 6.99(d, J=8.0Hz, 1H), 7.34(d, J=10.8Hz, 2H), 7.88(d, J=8.1Hz, 2H), 8.04(s, 1H), 8.18(d, J=8.0Hz, 1H), 8.70(s, 1H)
1-4	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.79(t, J=7.2Hz, 6H), 1.05-1.11(m, 4H), 1.39-1.50(m, 4H), 2.34-2.39(m, 1H), 2.97(s, 3H), 4.52(s, 2H), 5.65(s, 2H), 6.67(d, J=8.8Hz, 2H), 6.93(d, J=8.0Hz, 2H), 7.30(d, J=8.0Hz, 2H), 7.91(d, J=8.7Hz, 2H), 7.96-7.97(m, 1H), 8.12(s, 1H), 8.62(d, J=2.8Hz, 1H), 8.71(d, J=1.4Hz, 1H)
1-5	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.79(t, J=7.2Hz, 6H), 1.03-1.11(m, 4H), 1.39-1.50(m, 4H), 2.34-2.39(m, 1H), 2.97(s, 3H), 4.52(s, 2H), 5.56(s, 2H), , 6.67(d, J=8.8Hz, 2H), 6.93(d, J=8.8Hz, 2H), 7.15(d, J=8.8Hz, 2H), 7.30(d, J=8.8Hz, 2H), 7.91-7.93(m, 4H), 8.11(s, 1H)

表 17-2

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
1-6	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.85(t, J=7.3Hz, 6H), 1.10(d, J=6.8Hz, 6H), 1.25-1.64(m, 8H), 2.65-2.74(m, 1H), 3.84-3.91(m, 1H), 4.37(s, 2H), 5.77(s, 2H), 6.66(d, J=9.1Hz, 2H), 6.94(d, J=8.7Hz, 2H), 7.06(d, J=9.4Hz, 1H), 7.31(d, J=8.6Hz, 2H), 7.84(d, J=8.3Hz, 2H), 8.04(s, 1H), 8.22(dd, J=2.3, 8.7Hz, 1H), 8.75(dd, J=0.7, 2.6Hz, 1H), 13.05(brs, 1H)
1-7	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.85(t, J=7.2Hz, 6H), 1.11(d, J=6.8Hz, 6H), 1.25-1.64(m, 8H), 2.65-2.74(m, 1H), 3.83-3.92(m, 1H), 4.37(s, 2H), 5.65(s, 2H), 6.66(d, J=8.6Hz, 2H), 6.94(d, J=8.7Hz, 2H), 7.32(d, J=8.3Hz, 2H), 7.86(d, J=8.3Hz, 2H), 7.98-7.98(brs, 1H), 8.09(s, 1H), 8.63-8.63(brs, 1H), 8.72(s, 1H), 13.38(brs, 1H)
1-8	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.92(d, J=6.8Hz, 6H), 1.12(d, J=7.2Hz, 6H), 2.00-2.13(m, 1H), 2.67-2.78(m, 1H), 3.24(d, J=7.1Hz, 2H), 4.58(s, 2H), 5.66(s, 2H), 6.59(d, J=9.0Hz, 2H), 6.97(d, J=8.6Hz, 2H), 7.26(d, J=8.3Hz, 2H), 7.88(d, J=8.3Hz, 2H), 7.99-7.99(m, 1H), 8.10(s, 1H), 8.64(d, J=3.0Hz, 1H), 8.72(d, J=1.5Hz, 1H), 13.46(brs, 1H)
1-9	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.85(t, J=7.2Hz, 6H), 1.11(d, J=7.2Hz, 6H), 1.29-1.62(m, 8H), 2.65-2.74(m, 1H), 3.83-3.95(m, 1H), 4.37(s, 2H), 5.56(s, 2H), 6.66(d, J=8.6Hz, 2H), 6.94(d, J=8.7Hz, 2H), 7.17(d, J=9.1Hz, 2H), 7.32(d, J=8.3Hz, 2H), 7.85(d, J=8.3Hz, 2H), 7.92(d, J=9.0Hz, 2H), 8.07(s, 1H), 12.58(brs, 1H)
1-10	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.85(t, J=7.2Hz, 6H), 1.11(d, J=6.8Hz, 6H), 1.25-1.68(m, 8H), 2.65-2.75(m, 1H), 3.84-3.93(m, 1H), 4.37(s, 2H), 5.55(s, 2H), 6.66(d, J=8.7Hz, 2H), 6.94(d, J=8.7Hz, 2H), 7.32(d, J=8.3Hz, 2H), 7.35-7.36(m, 1H), 7.45(t, J=7.9Hz, 1H), 7.57-7.62(m, 2H), 7.86(d, J=8.3Hz, 2H), 8.06(s, 1H), 12.91(brs, 1H)

表 17-3

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
1-11	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.87(t, J = 6.0Hz, 6H), 1.09(d, J = 9.0Hz, 6H), 1.37-1.70(m, 4H), 2.65-2.72(m, 1H), 3.55-3.82(m, 1H), 4.35(s, 2H), 5.74(s, 2H), 6.67(d, J = 9.0Hz, 2H), 6.92(d, J = 9.0Hz, 2H), 7.04(d, J = 9.0Hz, 1H), 7.31(d, J = 9.0Hz, 2H), 7.82(d, J = 9.0Hz, 2H), 8.01(s, 1H), 8.20(d, J = 6.0Hz, 1H), 8.73(d, J = 3.0Hz, 1H)
1-12	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.88(t, J = 6.0Hz, 6H), 1.10(t, J = 6.0Hz, 6H), 1.37-1.72(m, 4H), 2.53-2.76(m, 1H), 3.57-3.84(m, 1H), 4.36(s, 2H), 5.63(s, 2H), 6.45-6.76(m, 2H), 6.83-7.07(m, 2H), 7.19-7.42(m, 2H), 7.80-7.86(m, 2H), 7.92-7.95(m, 1H), 8.04-8.08(m, 1H), 8.59(m, 1H), 8.7(m, 1H)
1-13	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.68 (t, J = 7.3 Hz, 6 H), 1.16 (d, J = 6.7 Hz, 6 H), 1.33-1.46 (m, 2 H), 1.49- 1.62 (m, 2 H), 2.07- 2.17 (m, 1 H), 4.22 (quit, J = 6.5 Hz, 1 H), 4.36 (s, 2 H), 4.78 (s, 2 H), 6.61 (d, J = 8.8 Hz, 2 H), 6.88 (d, J = 8.6 Hz, 2 H), 7.33 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 7.50 (d, J = 8.8 Hz, 2 H), 7.84 (d, J = 8.6 Hz, 4 H), 7.92 (s, 1 H), 12.80 (br s, 1 H).
1-14	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.79(t, J=7.2Hz, 6H), 1.03-1.11(m, 4H), 1.39-1.50(m, 4H), 2.34-2.39(m, 1H), 2.97(s, 3H), 4.50(s, 2H), 4.78(s, 2H), 6.66(d, J=8.8Hz, 2H), 6.93(d, J=8.4Hz, 2H), 7.28(d, J=8.0Hz, 2H), 7.50(d, J=8.0Hz, 2H), 7.82-7.85(m, 4H), 7.94(s, 1H)
1-15	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79(t, J=7.1Hz, 6H), 1.02-1.16(m, 4H), 1.35-1.52(m, 4H), 2.32-2.42(m, 1H), 2.87(s, 3H), 2.96(s, 3H), 4.51(s, 2H), 4.68(s, 2H), 6.67(d, J=8.8Hz, 2H), 6.94(d, J=8.8Hz, 2H), 7.27(d, J=8.1Hz, 2H), 7.79(d, J=8.4Hz, 2H), 7.97(d, J=8.8Hz, 2H), 8.02(s, 1H), 8.13(d, J=8.8Hz, 2H), 13.20(brs, 1H)
1-16	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79(t, J=7.3Hz, 6H), 1.02-1.15(m, 4H), 1.37-1.53(m, 4H), 1.78-1.88(m, 2H), 1.99(t, J=7.0Hz, 2H), 2.32-2.42(m, 1H), 2.89(s, 3H), 2.97(s, 3H), 3.21-3.26(m, 2H), 4.52(s, 2H), 4.67(s, 2H), 6.68(d, J=8.8Hz, 2H), 6.94(d, J=8.8Hz, 2H), 7.30(d, J=8.1Hz, 2H), 7.89(d, J=8.1Hz, 2H), 8.04(s, 1H)

表 17-4

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
1-17	DMSO-d ₆ , 400MHz	1.11-1.37(m, 5H), 1.61-1.78(m, 5H), 2.23-2.33(m, 1H), 3.09(s, 3H), 4.22(s, 2H), 4.83(s, 2H), 5.97(brs, 1H), 6.48(d, J=8.4Hz, 2H), 6.87(d, J=8.4Hz, 2H), 7.12(s, 1H), 7.34(d, J=8.6Hz, 2H), 7.44(d, J=8.1Hz, 2H), 7.78(d, J=8.2Hz, 2H), 7.92(d, J=8.6Hz, 2H), 12.78(brs, 1H)
1-18	DMSO-d ₆ , 400MHz	1.12-1.40(m, 5H), 1.63-1.82(m, 5H), 2.29-2.38(m, 1H), 2.96(s, 3H), 3.09(s, 3H), 4.49(s, 2H), 4.82(s, 2H), 6.65(d, J=8.6Hz, 2H), 6.99(d, J=8.6Hz, 2H), 7.12(s, 1H), 7.21(d, J=8.1Hz, 2H), 7.43(d, J=8.1Hz, 2H), 7.77(d, J=8.1Hz, 2H), 7.92(d, J=8.1Hz, 2H)
1-19	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.78(t, J=7.4Hz, 6H), 0.98-1.17(m, 4H), 1.32-1.54(m, 4H), 2.29-2.42(m, 1H), 2.95(s, 3H), 3.09(s, 3H), 4.49(s, 2H), 4.83(s, 2H), 6.66(d, J=8.7Hz, 2H), 6.93(d, J=8.7Hz, 2H), 7.14(s, 1H), 7.23(d, J=8.3Hz, 2H), 7.43(d, J=8.3Hz, 2H), 7.78(d, J=8.3Hz, 2H), 7.92(d, J=8.3Hz, 2H), 12.82(brs, 1H)
1-20	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.68(t, J=7.2Hz, 6H), 1.15(d, J=6.4Hz, 6H), 1.32-1.47(m, 2H), 1.49-1.64(m, 2H), 2.05-2.19(m, 1H), 3.09(s, 3H), 4.15-4.28(m, 1H), 4.34(s, 2H), 4.83(s, 2H), 6.61(d, J=8.6Hz, 2H), 6.87(d, J=8.6Hz, 2H), 7.12(s, 1H), 7.28(d, J=8.3Hz, 2H), 7.43(d, J=7.9Hz, 2H), 7.77(d, J=8.3Hz, 2H), 7.92(d, J=7.9Hz, 2H), 12.82(brs, 1H)
1-21	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.68 (t, J = 7.3 Hz, 6 H), 1.15 (d, J = 6.6 Hz, 6 H), 1.33-1.46 (m, 2 H), 1.48- 1.61 (m, 2 H), 2.06- 2.18 (m, 1 H), 2.34 (s, 3 H), 3.85 (d, J = 15.0 Hz, 1 H), 4.02 (d, J = 15.4 Hz, 1 H), 4.22 (quint, J = 6.6 Hz, 1 H), 4.36 (s, 2 H), 4.50 (s, 2 H), 6.62 (d, J = 8.4 Hz, 2 H), 6.88 (d, J = 8.8 Hz, 2 H), 7.32 (d, J = 8.0 Hz, 2 H), 7.34 (t, J = 7.1 Hz, 1 H), 7.40 (t, J = 7.0 Hz, 2 H), 7.47 (d, J = 7.0 Hz, 2 H), 7.84 (d, J = 8.1 Hz, 2 H), 7.93 (s, 1 H), 12.66 (br s, 1 H).

表 17-5

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
1-22	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.68 (t, J = 7.3 Hz, 6 H), 1.16 (d, J = 6.6 Hz, 6 H), 1.30-1.47 (m, 2 H), 1.48- 1.61 (m, 2 H), 2.07- 2.19 (m, 1 H), 2.37 (s, 3 H), 2.94 (dd, J = 14.1, 8.2 Hz, 1 H), 3.08 (dd, J = 13.9, 7.0 Hz, 1 H), 3.70 (t, J = 7.7 Hz, 1 H), 4.02 (d, J = 15.8 Hz, 1 H), 4.17 (d, J = 15.8 Hz, 1 H), 4.22 (t, J = 6.0 Hz, 1 H), 4.36 (s, 2 H), 6.62 (d, J = 8.8 Hz, 2 H), 6.88 (d, J = 8.8 Hz, 2 H), 7.16- 7.30 (m, 5 H), 7.32 (d, J = 8.4 Hz, 2 H), 7.83 (d, J = 8.4 Hz, 2 H), 7.86 (s, 1 H), 12.53 (br s, 1 H).
1-23	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.92 (d, J = 6.6 Hz, 6 H), 1.19 (s, 9 H), 2.05 (sept, J = 7.2 Hz, 1 H), 3.24 (d, J = 7.5 Hz, 2 H), 3.35 (s, 2 H), 3.86 (s, 2 H), 4.17 (s, 2 H), 4.57 (s, 2 H), 6.58 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.11 (d, J = 9.0 Hz, 2 H), 7.20- 7.45 (m, 5 H), 7.84 (d, J = 8.1 Hz, 2 H), 7.94 (s, 1 H), 13.38 (br s, 1 H).
1-24	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.92 (d, J = 6.6 Hz, 6 H), 2.05 (sept, J = 6.8 Hz, 1 H), 3.28 (d, J = 6.8 Hz, 2 H), 3.36 (s, 2 H), 3.86 (s, 2 H), 4.17 (s, 2 H), 4.61 (s, 2 H), 6.65 (d, J = 9.0 Hz, 2 H), 7.10 (d, J = 9.0 Hz, 2 H), 7.21 (d, J = 7.8 Hz, 2 H), 7.07- 7.43 (m, 5 H), 7.85 (d, J = 8.4 Hz, 2 H), 7.95 (s, 1 H), 12.37 (br s, 1 H).
1-25	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79 (t, J = 7.1 Hz, 6 H), 1.00- 1.28 (m, 4 H), 1.34- 1.58 (m, 4 H), 2.30- 2.42 (m, 3 H), 2.97 (s, 3 H), 3.36 (s, 2 H), 3.87 (s, 2 H), 4.18 (s, 2 H), 4.51 (s, 2 H), 6.67 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 6.93 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.28 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 7.22- 7.43 (m, 5 H), 7.87 (d, J = 8.4 Hz, 2 H), 7.97 (s, 1 H), 12.38 (br s, 1 H).
1-26	MeOH-d ₄ , 300MHz	0.70(t, J=7.3Hz, 6H), 1.26(d, J=6.4Hz, 6H), 1.36-1.53(m, 2H), 1.53-1.70(m, 2H), 2.11-2.24(m, 1H), 3.45(s, 2H), 3.97(s, 2H), 4.16-4.30(m, 3H), 4.50(s, 2H), 6.81(d, J=8.6Hz, 2H), 6.97(d, J=8.7Hz, 2H), 7.21-7.38(m, 5H), 7.44(d, J=6.7Hz, 2H), 7.68(s, 1H), 7.78(d, J=8.3Hz, 2H)

表 17-6

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
1-27	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.92 (d, J = 6.8 Hz, 6 H), 1.19 (s, 9 H), 2.05 (sept, J = 6.8 Hz, 1 H), 3.25 (d, J = 7.1 Hz, 2 H), 4.01 (s, 2 H), 4.58 (s, 2 H), 4.85 (s, 2 H), 6.60 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 6.93 (t, J = 7.3 Hz, 1 H), 7.11 (d, J = 9.1 Hz, 2 H), 7.23 (t, J = 7.9 Hz, 2 H), 7.24 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.43 (d, J = 7.5 Hz, 2 H), 7.85 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 7.94 (s, 1 H), 9.47 (br s, 1 H).
1-28	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.92 (d, J = 6.4 Hz, 6 H), 1.19 (s, 9 H), 2.05 (sept, J = 7.0 Hz, 1 H), 3.25 (d, J = 7.2 Hz, 2 H), 4.05- 4.25 (m, 2 H), 4.58 (s, 2 H), 4.76- 5.01 (m, 2 H), 6.59 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.11 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.26 (d, J = 7.9 Hz, 2 H), 7.33- 7.53 (m, 5 H), 7.81- 7.90 (m, 2 H), 7.97- 7.03 (m, 1 H), 12.84 (br s, 1 H).
1-29	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.91 (d, J = 6.6 Hz, 6 H), 1.22 (s, 9 H), 2.04 (sept, J = 6.8 Hz, 1 H), 3.19 (d, J = 7.0 Hz, 2 H), 4.36 (br s, 2 H), 4.54 (s, 2 H), 5.07 (s, 2 H), 6.67 (d, J = 8.8 Hz, 2 H), 7.13 (d, J = 8.8 Hz, 2 H), 7.26 (d, J = 8.4 Hz, 2 H), 7.47 (ddd, J = 7.6, 4.8, 1.2 Hz, 1 H), 7.70 (dt, J = 7.7, 1.1 Hz, 1 H), 7.81 (d, J = 8.1 Hz, 2 H), 7.82 (s, 1 H), 7.91 (td, J = 7.7, 1.8 Hz, 1 H), 8.56 (d, J = 4.8 Hz, 1 H).
1-30	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.92 (d, J = 6.6 Hz, 6 H), 1.22 (s, 9 H), 2.04 (sept, J = 6.8 Hz, 1 H), 3.20 (d, J = 7.0 Hz, 2 H), 4.18 (s, 2 H), 4.54 (s, 2 H), 4.93 (s, 2 H), 6.67 (d, J = 9.1 Hz, 2 H), 7.13 (d, J = 8.8 Hz, 2 H), 7.44 (ddd, J = 7.9, 5.0, 0.9 Hz, 1 H), 7.78- 7.86 (m, 4 H), 8.60- 8.65 (m, 2 H).
1-31	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.92 (d, J = 6.8 Hz, 6 H), 1.19 (s, 9 H), 2.05 (sept, J = 6.6 Hz, 1 H), 3.24 (d, J = 7.2 Hz, 2 H), 4.11 (s, 2 H), 4.58 (s, 2 H), 4.83 (s, 2 H), 6.58 (d, J = 9.0 Hz, 2 H), 7.11 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.23 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 7.55 (t, J = 7.5 Hz, 2 H), 7.63 (t, J = 7.3 Hz, 1 H), 7.76 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 7.86 (d, J = 7.5 Hz, 2 H), 7.95 (s, 1 H), 12.82 (br s, 1 H).

表 17-7

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
1-32	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.69 (t, J = 7.3 Hz, 6 H), 1.16 (d, J = 6.6 Hz, 6 H), 1.33-1.46 (m, 2 H), 1.47-1.64 (m, 2 H), 2.07-2.18 (m, 1 H), 3.09 (dd, J = 16.5, 3.3 Hz, 1 H), 3.18 (dd, J = 16.1, 6.2 Hz, 1 H), 3.94 (d, J = 16.1 Hz, 1 H), 3.97 (dd, J = 5.9, 3.6 Hz, 1 H), 4.09 (d, J = 15.8 Hz, 1 H), 4.21 (d, J = 6.2 Hz, 1 H), 4.26 (d, J = 8.4 Hz, 1 H), 4.37 (s, 2 H), 4.39 (d, J = 15.8 Hz, 1 H), 6.62 (d, J = 8.8 Hz, 2 H), 6.89 (d, J = 8.4 Hz, 2 H), 7.01-7.17 (m, 4 H), 7.34 (d, J = 8.1 Hz, 2 H), 7.87 (d, J = 8.0 Hz, 2 H), 7.94 (s, 1 H), 12.51 (br s, 1 H).
1-33	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.69(t, J=7.3Hz, 6H), 1.16(d, J=6.4Hz, 6H), 1.32-1.48(m, 2H), 1.48-1.65(m, 2H), 2.06-2.20(m, 1H), 3.09(dd, J=3.4, 16.2Hz, 1H), 3.18(dd, J=6.0, 16.2Hz, 1H), 3.86-4.00(m, 2H), 4.09(d, J=15.4Hz, 1H), 4.16-4.45(m, 5H), 6.62(d, J=8.7Hz, 2H), 6.88(d, J=8.7Hz, 2H), 6.99-7.19(m, 4H), 7.34(d, J=8.3Hz, 2H), 7.87(d, J=8.3Hz, 2H), 7.94(s, 1H), 12.55(brs, 1H)
1-34	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79(t, J=7.3Hz, 6H), 0.98-1.17(m, 4H), 1.33-1.58(m, 4H), 2.30-2.44(m, 1H), 2.98(s, 3H), 3.10(dd, J=2.6, 15.8Hz, 1H), 3.19(dd, J=6.0, 15.8Hz, 1H), 3.87-4.03(m, 2H), 4.10(d, J=15.5Hz, 1H), 4.26(d, J=15.8Hz, 1H), 4.41(d, J=15.8Hz, 1H), 4.52(s, 2H), 6.68(d, J=7.9Hz, 2H), 6.94(d, J=8.3Hz, 2H), 6.99-7.20(m, 4H), 7.29(d, J=8.3Hz, 2H), 7.88(d, J=7.9Hz, 2H), 7.97(s, 1H)
1-35	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.89(t, J = 9.0Hz, 6H), 1.09(t, J = 9.0Hz, 6H), 1.32-1.73(m, 4H), 2.61-2.75(m, 1H), 3.09(s, 2H), 3.65-3.74(m, 1H), 3.84-3.89(m, 2H), 4.06-4.19(m, 1H), 4.24-4.25(m, 1H), 4.33-4.40(m, 3H), 6.68(d, J = 9.0Hz, 2H), 6.91-6.94(m, 2H), 6.98-7.04(m, 1H), 7.10-7.13(m, 3H), 7.30(d, J = 6.0Hz, 2H), 7.81(d, J = 6.0Hz, 2H), 7.90(s, 1H)
1-36	DMSO-d ₆ , 400MHz	1.14-1.42(m, 5H), 1.64-1.82(m, 5H), 2.38-2.45(m, 1H), 3.60(s, 3H), 5.08(s, 2H), 6.92(d, J=8.6Hz, 2H), 7.12(d, J=8.6Hz, 2H), 7.41(s, 1H), 7.47(d, J=8.2Hz, 2H), 7.70(d, J=8.6Hz, 2H), 7.89(d, J=8.2Hz, 2H), 7.99(d, J=8.6Hz, 2H), 12.81(brs, 1H)

表 17-8

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
1-37	DMSO-d ₆ , 400MHz	1.14-1.42(m, 5H), 1.64-1.81(m, 5H), 2.37-2.46(m, 1H), 3.10(s, 3H), 4.84(s, 2H), 5.06(s, 2H), 6.91(d, J=8.6Hz, 2H), 7.12(d, J=8.6Hz, 2H), 7.20(s, 1H), 7.43(d, J=5.4Hz, 2H), 7.45(d, J=5.4Hz, 2H), 7.86(d, J=8.1Hz, 2H), 7.93(d, J=8.1Hz, 2H)
1-38	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.61(t, J=7.4Hz, 3H), 1.20(s, 6H), 1.57(q, J=7.3Hz, 2H), 3.10(s, 3H), 4.83(s, 2H), 5.06(s, 2H), 6.92(d, J=8.8Hz, 2H), 7.20-7.22(m, 3H), 7.43(d, J=8.8Hz, 4H), 7.85(d, J=8.0Hz, 2H), 7.91(d, J=8.0Hz, 2H)
1-39	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79(t, J=7.3Hz, 6H), 0.93-1.18(m, 4H), 1.32-1.59(m, 4H), 2.38-2.55(m, 1H), 3.11(s, 3H), 4.84(s, 2H), 5.06(s, 2H), 6.92(d, J=8.6Hz, 2H), 7.06(d, J=8.6Hz, 2H), 7.22(s, 1H), 7.45(d, J=8.2Hz, 4H), 7.87(d, J=8.2Hz, 2H), 7.93(d, J=8.2Hz, 2H), 12.83(brs, 1H)
1-40	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79(t, J=7.3Hz, 6H), 0.99-1.17(m, 4H), 1.38-1.60(m, 4H), 2.40-2.52(m, 1H), 3.07(s, 3H), 4.73(s, 2H), 5.06(s, 2H), 6.93(d, J=8.7Hz, 2H), 7.06(d, J=8.7Hz, 2H), 7.19-7.23(m, 3H), 7.45(d, J=8.3Hz, 2H), 7.82(d, J=7.9Hz, 2H), 7.89(d, J=8.3Hz, 2H)
1-41	MeOH-d ₄ , 300MHz	0.83(t, J=7.3Hz, 6H), 1.05-1.22(m, 4H), 1.40-1.64(m, 4H), 2.40-2.53(m, 1H), 2.61(s, 3H), 4.21(d, J=15.1Hz, 1H), 4.34(d, J=15.1Hz, 1H), 4.66(s, 1H), 5.08(s, 2H), 6.91(d, J=8.7Hz, 2H), 7.04(d, J=8.7Hz, 2H), 7.35-7.45(m, 3H), 7.46-7.59(m, 4H), 7.83(s, 1H), 7.93(d, J=8.3Hz, 2H)
1-42	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79(t, J=7.4Hz, 6H), 0.99-1.17(m, 4H), 1.36-1.61(m, 4H), 2.40(s, 3H), 2.40-2.52(m, 1H), 2.95(dd, J=8.3, 13.9Hz, 1H), 3.08(dd, J=7.1, 13.9Hz, 1H), 3.73(t, J=7.5Hz, 1H), 4.05(d, J=15.8Hz, 1H), 4.21(d, J=15.8Hz, 1H), 5.07(s, 2H), 6.93(d, J=8.7Hz, 2H), 7.07(d, J=8.7Hz, 2H), 7.16-7.33(m, 5H), 7.49(d, J=8.3Hz, 2H), 7.81-8.05(m, 3H)

表 17-9

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
1-43	DMSO-d ₆ , 300MHz	1.34 (s, 9 H), 2.23 (s, 3 H), 3.37 (s, 2 H), 3.88 (s, 2 H), 4.20 (s, 2 H), 5.12 (s, 2 H), 6.96 (s, 2 H), 7.04 (s, 1 H), 7.22-7.45 (m, 5 H); 7.53 (d, J = 8.4 Hz, 2 H), 7.97 (d, J = 8.1 Hz, 2 H), 8.05 (s, 1 H), 12.38 (br s, 1 H).
1-44	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79(t, J=7.3Hz, 6H), 0.95-1.18(m, 4H), 1.33-1.60(m, 4H), 2.40-2.54(m, 1H), 3.38(s, 2H), 3.88(s, 2H), 4.20(s, 2H), 5.08(s, 2H), 6.93(d, J=8.6Hz, 2H), 7.07(d, J=8.6Hz, 2H), 7.22-7.45(m, 5H); 7.50(d, J=8.2Hz, 2H), 7.96(d, J=8.2Hz, 2H), 8.05(s, 1H)
1-45	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.80(t, J=7.3Hz, 6H), 0.99-1.18(m, 4H), 1.37-1.61(m, 4H), 2.39-2.51(m, 1H), 3.10(dd, J=3.4, 16.2Hz, 1H), 3.19(dd, J=5.6, 15.8Hz, 1H), 3.88-4.03(m, 2H), 4.10(d, J=15.8Hz, 1H), 4.27(d, J=15.8Hz, 1H), 4.42(d, J=15.8Hz, 1H), 5.09(s, 2H), 6.94(d, J=8.6Hz, 2H), 7.01-7.20(m, 6H), 7.51(d, J=8.3Hz, 2H), 7.97(d, J=8.3Hz, 2H), 8.04(s, 1H), 12.56(brs, 1H)
1-46	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.80(t, J=7.3Hz, 6H), 0.99-1.18(m, 4H), 1.37-1.61(m, 4H), 2.39-2.51(m, 1H), 3.10(dd, J=3.4, 16.2Hz, 1H), 3.19(dd, J=5.6, 15.8Hz, 1H), 3.88-4.03(m, 2H), 4.10(d, J=15.8Hz, 1H), 4.27(d, J=15.8Hz, 1H), 4.42(d, J=15.8Hz, 1H), 5.09(s, 2H), 6.94(d, J=8.6Hz, 2H), 7.01-7.20(m, 6H), 7.51(d, J=8.3Hz, 2H), 7.97(d, J=8.3Hz, 2H), 8.04(s, 1H), 12.56(brs, 1H)
1-47	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.80(t, J=7.4Hz, 6H), 0.98-1.17(m, 4H), 1.36-1.60(m, 4H), 2.39-2.53(m, 1H), 3.10(dd, J=2.6, 15.8Hz, 1H), 3.19(dd, J=5.6, 16.2Hz, 1H), 3.88-4.02(m, 2H), 4.10(d, J=16.2Hz, 1H), 4.27(d, J=15.5Hz, 2H), 4.42(d, J=15.8Hz, 2H), 5.08(s, 2H), 6.94(d, J=8.3Hz, 2H), 7.01-7.21(m, 6H), 7.51(d, J=7.9Hz, 2H), 7.97(d, J=7.9Hz, 2H), 8.05(s, 1H), 12.59(brs, 1H)

表 17-10

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
1-48	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.80(t, J=7.2Hz, 6H), 1.02-1.15(m, 4H), 1.38-1.57(m, 4H), 2.41-2.48(m, 1H), 5.10(s, 2H), 5.69(s, 2H), 6.94(d, J=8.6Hz, 2H), 7.08(d, J=8.7Hz, 2H), 7.53(d, J=8.3Hz, 2H), 7.99-8.02(m, 3H), 8.21(s, 1H), 8.66(d, J=3.0Hz, 1H), 8.74(d, J=1.5Hz, 1H), 13.48(brs, 1H)
1-49	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.80(t, J=7.3Hz, 6H), 1.02-1.15(m, 4H), 1.38-1.58(m, 4H), 2.41-2.50(m, 1H), 5.10(s, 2H), 5.60(s, 2H), 6.94(d, J=8.7Hz, 2H), 7.07(d, J=9.0Hz, 2H), 7.19(d, J=9.1Hz, 2H), 7.53(d, J=8.3Hz, 2H), 7.93(d, J=9.1Hz, 2H), 8.00(d, J=8.3Hz, 2H), 8.19(s, 1H), 12.66(brs, 1H)
1-50	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.80(t, J=7.2Hz, 6H), 1.02-1.17(m, 4H), 1.38-1.56(m, 4H), 2.41-2.49(m, 1H), 2.88(s, 3H), 4.70(s, 2H), 5.08(s, 2H), 6.94(d, J=8.8Hz, 2H), 7.08(d, J=8.8Hz, 2H), 7.49(d, J=8.4Hz, 2H), 7.87(d, J=8.4Hz, 2H), 7.98(d, J=8.8Hz, 2H), 8.10(s, 1H), 8.14(d, J=8.8Hz, 2H), 13.38(brs, 1H)
1-51	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.80(t, J=7.3Hz, 6H), 1.02-1.15(m, 4H), 1.38-1.56(m, 4H), 1.88-1.98(m, 2H), 2.41(t, J=7.3Hz, 2H), 2.45-2.49(m, 1H), 2.92(s, 3H), 3.25-3.28(m, 2H), 4.72(s, 2H), 5.09(s, 2H), 6.94(d, J=8.8Hz, 2H), 7.08(d, J=8.8Hz, 2H), 7.52(d, J=8.4Hz, 2H), 7.97(d, J=8.1Hz, 2H), 8.13(s, 1H), 12.17(brs, 1H)
1-52	DMSO-d ₆ , 400MHz	1.16-1.46(m, 5H), 1.67-1.85(m, 5H), 2.40-2.56(m, 1H), 3.62(s, 3H), 7.20(d, J=8.6Hz, 2H), 7.58(s, 1H), 7.68(d, J=8.6Hz, 2H), 7.71(d, J=9.2Hz, 2H), 7.95-8.05(m, 6H), 10.14(s, 1H), 12.75(brs, 1H)
1-53	DMSO-d ₆ , 400MHz	1.17-1.45(m, 5H), 1.67-1.83(m, 5H), 2.43-2.52(m, 1H), 3.13(s, 3H), 4.86(s, 2H), 7.19(d, J=8.6Hz, 2H), 7.39(s, 1H), 7.46(d, J=8.6Hz, 2H), 7.67(d, J=8.6Hz, 2H), 7.94(d, J=8.6Hz, 2H), 7.96(d, J=9.2Hz, 2H), 7.99(d, J=9.2Hz, 2H), 10.11(s, 1H), 12.69(brs, 1H)

表 17-11

实施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
1-54	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.82(t, J=7.2Hz, 6H), 1.01-1.21(m, 4H), 1.41-1.63(m, 4H), 3.39(s, 2H), 3.89(s, 2H), 4.22(s, 2H), 7.14(d, J=8.6Hz, 2H), 7.24-7.46(m, 5H), 7.68(d, J=8.3Hz, 2H), 8.02(d, J=8.7Hz, 2H), 8.09(d, J=8.7Hz, 2H), 8.23(s, 1H), 10.19(s, 1H), 12.42(brs, 1H)
1-55	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79(t, J = 6.0Hz, 6H), 1.04-1.12(m, 4H), 1.45-1.56(m, 4H), 2.43-2.48(m, 1H), 3.38(s, 2H), 3.88(s, 2H), 4.21(s, 2H), 4.47(d, J = 6.0Hz, 2H), 7.12(d, J = 9.0Hz, 2H), 7.23-7.45(m, 8H), 7.97(d, J = 9.0Hz, 2H), 8.04(d, J = 9.0Hz, 2H), 8.19(s, 1H), 9.03(t, J = 6.0Hz, 1H)
1-56	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.80(t, J = 6.0Hz, 6H), 1.06-1.18(m, 4H), 1.47-1.54(m, 4H), 2.88(s, 3H), 3.37(s, 2H), 3.88(s, 2H), 4.20(s, 2H), 4.50-4.64(m, 2H), 7.17(d, J = 9.0Hz, 2H), 7.25-7.42(m, 10H), 7.51(d, J = 6.0Hz, 2H), 8.00(d, J = 6.0Hz, 2H), 8.14(s, 1H)
1-57	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.80(t, J = 6.0Hz, 6H), 0.93-1.24(m, 10H), 1.40-1.67(m, 4H), 3.37(s, 2H), 3.88(s, 2H), 4.20(s, 2H), 4.48-4.65(m, 1H), 7.15-7.49(m, 12H), 8.00(d, J = 6.0Hz, 2H), 8.13(s, 1H)
1-58	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.77(t, J=7.3Hz, 6H), 1.00-1.10(m, 4H), 1.19(s, 6H), 1.33-1.48(m, 4H), 2.27-2.37(m, 1H), 3.40(s, 2H), 4.45(brs, 1H), 4.72(s, 2H), 5.66(s, 2H), 6.66(d, J=8.6Hz, 2H), 6.84(d, J=8.8Hz, 2H), 7.27(d, J=8.0Hz, 2H), 7.87(d, J=8.3Hz, 2H), 7.98-7.99(m, 1H), 8.10(s, 1H), 8.64(d, J=2.9Hz, 1H), 8.73(d, J=1.4Hz, 1H)
1-59	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.92 (d, J = 6.5 Hz, 6 H), 1.19 (s, 9 H), 2.05 (sept, J = 6.7 Hz, 1 H), 3.19 (t, J = 4.5 Hz, 4 H), 3.24 (d, J = 7.2 Hz, 2 H), 3.57 (t, J = 4.5 Hz, 4 H), 3.92 (s, 2 H), 4.58 (s, 2 H), 4.68 (s, 2 H), 6.58 (d, J = 8.8 Hz, 2 H), 7.10 (d, J = 9.0 Hz, 2 H), 7.24 (d, J = 8.4 Hz, 2 H), 7.84 (d, J = 8.1 Hz, 2 H), 7.95 (s, 1 H), 12.69 (br s, 1 H).

表 17-12

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
1-60	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.69 (t, J = 7.4 Hz, 6 H), 1.16 (d, J = 6.8 Hz, 6 H), 1.31-1.48 (m, 2 H), 1.48-1.64 (m, 2 H), 2.06-2.19 (m, 1 H), 4.23 (sept, J = 6.6 Hz, 1 H), 4.38 (s, 2 H), 5.56 (s, 2 H), 6.62 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 6.89 (d, J = 8.6 Hz, 2 H), 7.36 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 7.80 (dd, J = 3.0, 1.5 Hz, 1 H), 7.90 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 8.08 (s, 1 H), 8.31 (d, J = 3.0 Hz, 1 H), 8.61 (d, J = 1.1 Hz, 1 H).
1-61	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79(t, J = 9.0Hz, 6H), 1.02-1.11(m,4H), 1.40-1.56(m,4H), 2.40-2.51(m,1H), 2.95-3.00(m,1H), 3.14-3.22(m,1H), 3.31-3.36(m,2H), 3.69(d,J = 15.0Hz, 1H), 4.28-4.42(m,3H), 5.07(s,2H), 6.91-7.08(m,8H), 7.49(d,J = 9.0Hz, 2H), 7.96(d,J = 9.0Hz, 2H), 7.97(s,1H)
1-62	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.80 (t, J = 7.2 Hz, 6 H), 1.00-1.17 (m, 4 H), 1.35-1.62 (m, 4 H), 2.40-2.53 (m, 1 H), 5.09 (s, 2 H), 5.58 (s, 2 H), 6.94 (d, J = 8.6 Hz, 2 H), 7.08 (d, J = 9.0 Hz, 2 H), 7.53 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 7.80 (dd, J = 3.0, 1.5 Hz, 1 H), 8.00 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 8.18 (s, 1 H), 8.32 (d, J = 3.0 Hz, 1 H), 8.61 (d, J = 1.1 Hz, 1 H).
1-63	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.68(t, J = 7.3 Hz, 6H), 1.16(d, J = 6.5 Hz, 6H), 1.34-1.45(m, 2H), 1.50-1.61(m, 2H), 2.09-2.16(m, 1H), 3.79 (s, 3H), 4.23(sep, J = 6.5 Hz, 1H), 4.37(s, 2H), 5.54 (s, 2H), 6.62(d, J = 8.6 Hz, 2H), 6.88(d, J = 8.6 Hz, 2H), 6.92(t, J = 2.4 Hz, 1H), 7.10(dd, J = 2.4, 1.2 Hz, 1H), 7.22(dd, J = 2.4, 1.2 Hz, 1H), 7.35 (d, J = 8.6 Hz, 2H), 7.89 (d, J = 8.6 Hz, 2H), 8.08(s, 1H), 13.03(brs, 1H)
1-64	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.68(t, J = 7.3 Hz, 6H), 1.16(d, J = 6.6 Hz, 6H), 1.32-1.47(m, 2H), 1.49-1.63(m, 2H), 2.08-2.17(m, 1H), 4.05(s, 2H), 4.22(sep, J = 6.6 Hz, 1H), 4.37(s, 2H), 4.87(s, 2H), 6.62(d, J = 8.4 Hz, 2H), 6.89(d, J = 8.4 Hz, 2H), 6.93(t, J = 7.3 Hz, 1H), 6.94(t, J = 7.3 Hz, 2H), 7.34(d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.44(d, J = 7.3 Hz, 2H), 7.87 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.94(s, 1H), 9.49(brs, 1H)

表 17-13

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
1-65	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.68(t, J = 7.3 Hz, 6H), 1.16(d, J = 6.6 Hz, 6H), 1.32-1.47(m, 2H), 1.49-1.63(m, 2H), 2.08-2.18(m, 1H), 2.22(s, 3H), 4.19-4.28(m, 3H), 4.37(s, 2H), 4.89(s, 2H), 6.62(d, J = 8.4 Hz, 2H), 6.89(d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.04(d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.33(d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.34(d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.87(d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.95(s, 1H), 8.80(brs, 1H), 12.70(brs, 1H)
1-66	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.68(t, J = 7.3 Hz, 6H), 1.16(d, J = 7.0 Hz, 12H), 1.33-1.47(m, 2H), 1.49-1.63(m, 2H), 2.06-2.17(m, 1H), 2.80(sep, J = 7.0 Hz, 1H), 4.04(s, 2H), 4.22(sep, J = 7.0 Hz, 1H), 4.37(s, 2H), 4.86(s, 2H), 6.62(d, J = 8.4 Hz, 2H), 6.88(d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.09(d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.34(d, J = 8.4 Hz, 4H), 7.87(d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.93(s, 1H), 9.32(brs, 1H)
1-67	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.68(t, J = 7.3 Hz, 6H), 1.16(d, J = 6.6 Hz, 6H), 1.32-1.47(m, 2H), 1.49-1.63(m, 2H), 2.08-2.18(m, 1H), 3.08(s, 3H), 3.81(s, 2H), 4.22(sep, J = 6.6 Hz, 1H), 4.37(s, 2H), 4.63(s, 2H), 6.62(d, J = 8.8 Hz, 2H), 6.88(d, J = 8.8 Hz, 2H), 7.10-7.15(m, 1H), 7.26-7.36(m, 6H), 7.84(d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.93(s, 1H), 12.42(brs, 1H)
1-68	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.77(t, J = 7.3 Hz, 6H), 1.02-1.11(m, 4H), 1.16(d, J = 6.5 Hz, 6H), 1.33-1.51(m, 4H), 2.29-2.37(m, 1H), 4.22(sep, J = 6.5 Hz, 1H), 4.36(s, 2H), 5.66(s, 2H), 6.59(d, J = 8.8 Hz, 2H), 6.87(d, J = 8.8 Hz, 2H), 7.35(d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.89(d, J = 8.4 Hz, 4H), 7.98(dd, J = 3.0, 1.6 Hz, 1H), 8.10(s, 1H), 8.63(d, J = 3.0 Hz, 1H), 8.71(d, J = 1.6 Hz, 1H), 13.44(brs, 1H)
1-69	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.80(t, J=7.0Hz, 6H), 0.98-1.18(m, 4H), 1.36-1.60(m, 4H), 2.39-2.54(m, 1H), 4.18(s, 2H), 4.91(s, 2H), 5.09(s, 2H), 6.94(d, J=8.7Hz, 2H), 6.95(t, J=8.6Hz, 2H), 7.07(d, J=8.7Hz, 2H), 7.24(t, J=7.8Hz, 2H), 7.46(d, J=7.5Hz, 2H), 7.51(d, J=8.1Hz, 2H), 7.97(d, J=8.1Hz, 2H), 8.05(s, 1H), 9.11(brs, 1H)

表 17-14

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
1-70	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.68(t, J = 7.3 Hz, 6H), 1.16(d, J = 6.6 Hz, 6H), 1.33-1.47(m, 2H), 1.49-1.60(m, 2H), 2.08-2.17(m, 7H), 4.18-4.25(m, 3H), 4.37(s, 2H), 4.90 (s, 2H), 6.62(d, J = 8.8 Hz, 2H), 6.88(d, J = 8.8 Hz, 2H), 7.02(s, 2H), 7.34(d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.86(d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.96(s, 1H), 8.16(brs, 1H), 12.70(brs, 1H)
1-71	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.68(t, J = 7.3 Hz, 6H), 1.16(d, J = 6.6 Hz, 6H), 1.33-1.47(m, 2H), 1.49-1.63(m, 2H), 2.08-2.18(m, 1H), 3.44(brs, 2H), 3.56(brs, 2H), 4.21(sep, J = 6.6 Hz, 1H), 4.22(s, 2H), 4.36(s, 2H), 6.61(d, J = 8.8 Hz, 2H), 6.88 (d, J = 8.8 Hz, 2H), 7.01-7.04(m, 1H), 7.23-7.31(m, 4H), 7.61(d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.84(d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.94(s, 1H), 10.94(brs, 1H)
1-72	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.68(t, J=7.2Hz, 6H), 1.16(d, J=6.3Hz, 6H), 1.33(d, J=6.6Hz, 6H), 1.37-1.65(m, 4H), 2.06-2.21(m, 1H), 3.50-3.70(m, 1H), 4.06(s, 2H), 4.14-4.29(m, 1H), 4.37(s, 2H), 4.84(s, 2H), 6.62(d, J=8.4Hz, 2H), 6.88(d, J=8.4Hz, 2H), 7.35(d, J=7.8Hz, 2H), 7.86(d, J=8.1Hz, 2H), 8.01(s, 1H), 12.22(brs, 1H)
1-73	DMSO-d ₆ , 400MHz	14.43(brs, 1H), 8.12(s, 1H), 7.88(d, J=8.4Hz, 2H), 7.35(d, J=8.4Hz, 2H), 7.07(s, 1H), 6.87(d, J=8.8Hz, 2H), 6.60(d, J=8.8Hz, 2H), 5.66(s, 2H), 4.37(s, 2H), 4.17-4.27(m, 1H), 2.27-2.39(m, 1H), 1.32-1.52(m, 4H), 1.16(d, J=6.4Hz, 6H), 0.99-1.12(m, 4H), 0.78(t, J=7.2Hz, 6H)
1-74	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.86 (t, J = 7.5 Hz, 6 H), 1.12 (d, J = 6.8 Hz, 6 H), 1.22-1.45 (m, 4 H), 1.70 (sept, J = 6.0 Hz, 1 H), 2.71 (sept, J = 6.8 Hz, 1 H), 3.33 (s, 2 H), 4.57 (s, 2 H), 5.66 (s, 2 H), 6.97 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.26 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 7.88 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 7.98 (dd, J = 3.0, 1.5 Hz, 1 H), 8.11 (s, 1 H), 8.64 (d, J = 3.0 Hz, 1 H), 8.72 (d, J = 1.9 Hz, 1 H), 13.44 (br s, 1 H).

表 17-15

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
1-75	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.68(t, J=7.4Hz, 6H), 1.15(d, J=6.4Hz, 6H), 1.32-1.66(m, 10H), 2.06-2.16(m, 1H), 2.92-2.98(m, 2H), 3.07-3.18(m, 2H), 3.31-3.48(m, 1H), 3.72(s, 1H), 4.01-4.09(m, 1H), 4.16-4.27(m, 1H), 4.36(s, 2H), 4.62(s, 1H), 6.60(d, J=8.8Hz, 2H), 6.87(d, J=8.4Hz, 2H), 7.32(d, J=7.6Hz, 2H), 7.84(d, J=8.0Hz, 2H), 7.91(s, 1H)
1-76	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.80 (t, J = 7.3 Hz, 6 H), 0.99- 1.18 (m, 4 H), 1.35- 1.61 (m, 4 H), 2.40- 2.55 (m, 1 H), 5.09 (s, 2 H), 5.79 (s, 2 H), 6.94 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.07 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.18 (dd, J = 7.4, 5.1 Hz, 1 H), 7.52 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 7.99 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 8.20 (dd, J = 7.3, 2.1 Hz, 1 H), 8.40 (dd, J = 4.9, 1.9 Hz, 1 H), 13.08 (br s, 1 H).
1-77	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.68 (t, J = 7.4 Hz, 6H), 1.15(d, J = 6.6 Hz, 6H), 1.34-1.45(m, 2H), 1.49-1.63(m, 2H), 2.08-2.15(m,1H), 2.22(s,3H), 3.41(brs, 2H), 3.53(brs, 2H), 4.18-4.23(m, 3H), 4.35(s, 2H), 6.60(d, J = 8.8 Hz, 2H), 6.87(d, J = 8.8 Hz, 2H), 7.06(d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.32(d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.51(d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.84 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.93(s, 1H), 10.91(brs, 1H)
1-78	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.68 (t, J = 7.3 Hz, 6H), 1.15(d, J = 6.5 Hz, 6H), 1.16(d, J = 6.5 Hz, 6H), 1.34-1.45(m, 2H), 1.50-1.60 (m, 2H), 2.08-2.16(m, 1H), 2.82(sep, J = 6.5 Hz, 1H), 3.55(s, 2H), 3.61(s, 2H), 4.22(sep, J = 6.5 Hz, 1H), 4.26(s, 2H), 4.36(s, 2H), 6.60(d, J = 8.8 Hz, 2H), 6.87(d, J = 8.8 Hz, 2H), 7.14(d, J = 8.3 Hz, 2H), 7.31(d, J = 8.3 Hz, 2H), 7.49(d, J = 8.3Hz, 2H), 7.84(d, J = 8.3 Hz, 2H), 7.95(s, 1H), 10.01(brs, 1H), 12.67(brs, 1H)
1-79	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.77(t, J = 7.3 Hz, 6H), 1.01-1.10(m,4H), 1.15(d, J = 6.6 Hz, 6H), 1.34-1.50(m, 4H), 2.28-2.38(m, 1H), 3.08(s, 3H), 3.67(s, 2H), 4.22(sep, J = 6.6 Hz, 1H), 4.36(s, 2H), 4.66(s, 2H), 6.61(d, J = 8.4 Hz, 2H), 6.88(d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.06-7.11(m, 1H), 7.25-7.35(m, 6H), 7.84(d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.92(s, 1H)

表 17-16

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
1-80	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.78(t, J = 7.3 Hz, 6H), 1.01-1.11(m, 4H), 1.16(d, J = 6.6 Hz, 6H), 1.35-1.48(m, 4H), 2.23(s, 3H), 2.31-2.39(m, 1H), 4.19-4.26(m, 3H), 4.37(s, 2H), 4.89(s, 2H), 6.61(d, J = 8.4 Hz, 2H), 6.89(d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.05(d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.33(d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.34(d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.87(d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.96(s, 1H), 8.76(brs, 1H), 12.71(brs, 1H)
1-81	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.77(t, J=7.4Hz, 6H), 0.99-1.11(m, 4H), 1.15(d, J=6.4Hz, 6H), 1.31-1.52(m, 4H), 2.27-2.37(m, 1H), 3.01(t, J=8.4Hz, 2H), 3.86(t, J=8.2Hz, 2H), 4.02(s, 2H), 4.16-4.26(m, 1H), 4.36(s, 2H), 4.82(s, 2H), 6.59(d, J=8.8Hz, 2H), 6.87(d, J=8.8Hz, 2H), 6.83-6.92(m, 1H), 7.11(t, J=8.2Hz, 1H), 7.19(d, J=7.6Hz, 1H), 7.25(d, J=8.0Hz, 1H), 7.33(d, J=8.4Hz, 2H), 7.86(d, J=8.4Hz, 2H), 7.97(s, 1H), 13.03(brs, 1H)
1-82	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.80 (t, J = 7.3 Hz, 6 H), 0.99- 1.19 (m, 4 H), 1.37- 1.60 (m, 4 H), 2.40- 2.53 (m, 1 H), 5.09 (s, 2 H), 5.63 (s, 2 H), 6.94 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.08 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.53 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 7.54 (dd, J = 8.5, 4.7 Hz, 1 H), 7.80 (dd, J = 8.7, 1.1 Hz, 1 H), 7.99 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 8.19 (s, 1 H), 8.23 (dd, J = 4.5, 1.1 Hz, 1 H), 13.22 (br s, 1 H).
1-83	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.86 (t, J = 7.3 Hz, 6 H), 1.12 (d, J = 6.8 Hz, 6 H), 1.23- 1.44 (m, 4 H), 1.70 (sept, J = 6.4 Hz, 1 H), 2.71 (sept, J = 7.0 Hz, 1 H), 3.30 (d, J = 7.0 Hz, 2 H), 3.52- 3.69 (m, 4 H), 4.28 (s, 2 H), 4.53 (s, 2 H), 6.59 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 6.97 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.04 (t, J = 7.4 Hz, 1 H), 7.22 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 7.29 (t, J = 7.9 Hz, 2 H), 7.59 (d, J = 7.5 Hz, 2 H), 7.84 (d, J = 7.9 Hz, 2 H), 7.96 (s, 1 H), 10.05 (br s, 1 H), 12.54 (br s, 1 H).

表 17-17

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
1-84	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.86 (t, J = 7.4 Hz, 6 H), 1.12 (d, J = 6.8 Hz, 6 H), 1.17 (d, J = 6.8 Hz, 6 H), 1.26- 1.44 (m, 4 H), 1.63- 1.75 (m, 1 H), 2.71 (sept, J = 7.0 Hz, 1 H), 2.83 (sept, J = 7.0 Hz, 1 H), 3.30 (d, J = 7.0 Hz, 2 H), 3.50- 3.70 (m, 4 H), 4.27 (s, 2 H), 4.55 (s, 2 H), 6.59 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 6.97 (d, J = 8.6 Hz, 2 H), 7.15 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 7.22 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 7.49 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.84 (d, J = 7.9 Hz, 2 H), 7.97 (s, 1 H), 9.93 (br s, 1 H), 12.55 (br s, 1 H).
1-85	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.86 (t, J = 7.4 Hz, 6 H), 1.12 (d, J = 6.8 Hz, 6 H), 1.22- 1.45 (m, 4 H), 1.69 (sept, J = 6.6 Hz, 1 H), 2.71 (sept, J = 7.0 Hz, 1 H), 3.30 (d, J = 6.8 Hz, 2 H), 3.60- 3.69 (m, 4 H), 4.28 (s, 2 H), 6.59 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 6.97 (d, J = 8.6 Hz, 2 H), 7.22 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 7.70 (d, J = 9.0 Hz, 2 H), 7.83 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 7.88 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.95 (s, 1 H), 10.33 (s, 1 H), 12.66 (br s, 2 H).
1-86	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.80 (t, J = 7.3 Hz, 6 H), 0.98- 1.18 (m, 4 H), 1.36- 1.61 (m, 4 H), 2.40- 2.53 (m, 1 H), 5.09 (s, 2 H), 5.81 (s, 2 H), 6.94 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.07 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.22 (d, J = 7.5 Hz, 1 H), 7.52 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 7.75 (d, J = 7.5 Hz, 1 H), 7.96 (dd, J = 8.1, 7.3 Hz, 1 H), 7.99 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 8.15 (s, 1 H), 13.17 (br s, 1 H).
1-87	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.78(t, J=7.2Hz, 6H), 0.92(d, J=6.6Hz, 6H), 1.01-1.14(m, 4H), 1.33-1.56(m, 4H), 1.98-2.10(m, 1H), 2.27-2.40(m, 1H), 3.24(d, J=7.2Hz, 2H), 4.58(s, 2H), 5.55(s, 2H), 6.60(d, J=8.7Hz, 2H), 6.89(d, J=8.4Hz, 2H), 7.27(d, J=8.4Hz, 2H), 7.78(dd, J=3.0, 1.5Hz, 1H), 7.89(d, J=8.1Hz, 2H), 8.09(s, 1H), 8.30(d, J=3.3Hz, 1H), 8.60(d, J=0.9Hz, 1H)

表 17-18

实施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
1-88	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.78(t, J=7.2Hz, 6H), 0.92(d, J=6.9Hz, 6H), 1.00-1.16(m, 4H), 1.32-1.50(m, 4H), 1.97-2.11(m, 1H), 2.25-2.39(m, 1H), 3.23(d, J=7.2Hz, 2H), 3.97(brs, 2H), 4.57(s, 2H), 4.84(s, 2H), 6.59(d, J=9.3Hz, 2H), 6.86-6.97(m, 3H), 7.20-7.28(m, 4H), 7.42(d, J=8.4Hz, 2H), 7.86(d, J=7.8Hz, 2H), 7.95(s, 1H)
1-89	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.68(t, J=7.3Hz, 6H), 1.16(d, J=6.8Hz, 6H), 1.35-1.63(m, 4H), 2.08-2.18(m, 1H), 3.89(s, 3H), 4.19-4.28(m, 1H), 4.38(s, 2H), 5.68(s, 2H), 6.62(d, J=9.0Hz, 2H), 6.88(d, J=8.7Hz, 2H), 7.36(d, J=8.3Hz, 2H), 7.90(d, J=8.3Hz, 2H), 8.02-8.04(m, 1H), 8.11(s, 1H), 8.68(d, J=2.6Hz, 1H), 8.74(d, J=1.9Hz, 1H)
1-90	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.69 (t, J = 7.3 Hz, 6 H), 1.16 (d, J = 6.5 Hz, 6 H), 1.25-1.65 (m, 4 H), 2.05- 2.20 (m, 1 H), 4.15- 4.30 (m, 1 H), 4.38 (s, 2 H), 5.49 (s, 2 H), 5.62 (s, 2 H), 6.62 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 6.68 (d, J = 8.2 Hz, 1 H), 6.89 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.35- 7.45 (m, 3 H), 7.51 (br s, 1 H), 7.90 (d, J = 8.2 Hz, 2 H), 8.08 (s, 1 H).
1-91	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.69 (t, J = 7.3 Hz, 6 H), 1.16 (d, J = 6.6 Hz, 6 H), 1.30-1.65 (m, 4 H), 2.05- 2.20 (m, 1 H), 4.15- 4.30 (m, 1 H), 4.38 (s, 2 H), 5.56 (s, 2 H), 6.62 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 6.68 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 7.30- 7.40 (m, 3 H), 7.45 (t, J = 7.7 Hz, 1 H), 7.58 (d, J = 7.7 Hz, 1 H), 7.62 (br s, 1 H), 7.90 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 8.08 (s, 1 H).
1-92	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.69 (t, J = 7.3 Hz, 6 H), 1.16 (d, J = 6.6 Hz, 6 H), 1.30-1.65 (m, 4 H), 2.05- 2.20 (m, 1 H), 4.15- 4.30 (m, 1 H), 4.37 (s, 2 H), 4.65 (d, J = 6.0 Hz, 2 H), 6.62 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 6.70- 7.00 (m, 4 H), 7.20- 7.30 (m, 3 H), 7.34 (d, J = 8.4 Hz, 2 H), 7.80- 7.90 (m, 3 H), 12.66 (br s, 1 H).

表 17-19

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
1-93	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.68 (t, J = 7.3 Hz, 6 H), 1.16 (d, J = 6.5 Hz, 6 H), 1.35-1.65 (m, 4 H), 2.10- 2.20 (m, 1 H), 4.20- 4.30 (m, 1 H), 4.37 (s, 2 H), 5.78 (s, 2 H), 6.61 (d, J = 8.8 Hz, 2 H), 6.88 (d, J = 8.8 Hz, 2 H), 7.35 (d, J = 8.4 Hz, 2 H), 7.69 (dd, J = 8.3, 1.5 Hz, 1 H), 7.89 (d, J = 8.4 Hz, 2 H), 8.01 (d, J = 8.3 Hz, 1 H), 8.05 (d, J = 1.5 Hz, 1 H), 8.10 (s, 1 H).
1-94	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.77(t, J=7.3Hz, 6H), 0.98-1.21(m, 10H), 1.31-1.54(m, 4H), 2.25-2.41(m, 1H), 3.61(s, 2H), 4.14-4.43(m, 7H), 6.60(d, J=8.7Hz, 2H), 6.89(d, J=8.7Hz, 2H), 7.17-7.26(m, 2H), 7.32(d, J=8.3Hz, 2H), 7.52-7.61(m, 2H), 7.83(d, J=8.3Hz, 2H), 7.94(s, 1H)
1-95	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79 (t, J = 7.3 Hz, 6 H), 0.99- 1.18 (m, 4 H), 1.35- 1.61 (m, 4 H), 2.40- 2.54 (m, 1 H), 3.60 (s, 2 H), 3.66 (s, 2 H), 4.30 (s, 2 H), 5.08 (s, 2 H), 6.93 (d, J = 9.0 Hz, 2 H), 7.05 (t, J = 7.3 Hz, 1 H), 7.07 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.30 (t, J = 7.9 Hz, 2 H), 7.49 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 7.60 (d, J = 7.6 Hz, 2 H), 7.95 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 8.06 (s, 1 H), 10.01 (s, 1 H), 12.65 (br s, 1 H).
1-96	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.80 (t, J = 7.3 Hz, 6 H), 0.96- 1.16 (m, 4 H), 1.36- 1.59 (m, 4 H), 2.38- 2.54 (m, 1 H), 3.66 (s, 2 H), 3.67 (s, 2 H), 4.31 (s, 2 H), 5.08 (s, 2 H), 6.93 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.07 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.34 (dd, J = 8.3, 4.5 Hz, 1 H), 7.49 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 7.95 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 8.05 (ddd, J = 8.5, 2.4, 1.5 Hz, 1 H), 8.05 (s, 1 H), 8.26 (dd, J = 4.9, 1.5 Hz, 1 H), 8.73 (d, J = 2.6 Hz, 1 H), 10.20 (s, 1 H), 12.63 (br s, 1 H).
1-97	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79 (t, J = 7.3 Hz, 6 H), 0.99- 1.17 (m, 4 H), 1.37- 1.60 (m, 4 H), 2.39- 2.52 (m, 1 H), 2.84 (s, 6 H), 3.54 (s, 2 H), 3.64 (s, 2 H), 4.28 (s, 2 H), 5.08 (s, 2 H), 6.69 (d, J = 9.1 Hz, 2 H), 6.93 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.07 (d, J = 8.6 Hz, 2 H), 7.41 (d, J = 9.0 Hz, 2 H), 7.49 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 7.95 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 8.06 (s, 1 H), 9.70 (s, 1 H), 12.63 (br s, 1 H).

表 17-20

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
1-98	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79 (t, J = 7.3 Hz, 6 H), 0.99- 1.16 (m, 4 H), 1.36- 1.60 (m, 4 H), 2.39- 2.52 (m, 1 H), 3.57 (s, 2 H), 3.65 (s, 2 H), 3.72 (s, 3 H), 4.29 (s, 2 H), 5.08 (s, 2 H), 6.88 (d, J = 9.0 Hz, 2 H), 6.93 (d, J = 8.6 Hz, 2 H), 7.07 (d, J = 8.6 Hz, 2 H), 7.49 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 7.51 (d, J = 9.1 Hz, 2 H), 7.95 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 8.06 (s, 1 H), 9.86 (s, 1 H), 12.63 (br s, 1 H).
1-99	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79 (t, J = 7.3 Hz, 6 H), 0.96 (d, J = 6.8 Hz, 6 H), 1.00- 1.14 (m, 4 H), 1.36- 1.58 (m, 4 H), 2.38- 2.53 (m, 1 H), 3.16 (s, 2 H), 3.53 (s, 2 H), 4.17 (s, 2 H), 4.83 (t, J = 6.4 Hz, 1 H), 5.09 (s, 2 H), 6.94 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.07 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.10- 7.16 (m, 2 H), 7.33- 7.40 (m, 3 H), 7.51 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 7.93 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 8.01 (s, 1 H), 12.44 (br s, 1 H).
1-100	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79 (t, J = 7.3 Hz, 6 H), 0.98- 1.16 (m, 4 H), 1.36- 1.61 (m, 4 H), 2.40- 2.54 (m, 1 H), 3.64 (s, 4 H), 4.30 (s, 2 H), 5.08 (s, 2 H), 6.93 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 7.07 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.11 (ddd, J = 7.2, 4.8, 1.0 Hz, 1 H), 7.49 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 7.78 (ddd, J = 8.4, 7.2, 1.0 Hz, 1 H), 7.97 (d, J = 7.9 Hz, 2 H), 8.06 (s, 1 H), 8.09 (d, J = 8.3 Hz, 1 H), 8.31 (ddd, J = 4.9, 1.9, 0.7 Hz, 1 H), 10.22 (s, 1 H), 12.61 (br s, 1 H).
1-101	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79 (t, J = 7.2 Hz, 6 H), 0.99- 1.17 (m, 4 H), 1.35- 1.60 (m, 4 H), 1.71- 1.93 (m, 4 H), 2.40- 2.54 (m, 1 H), 3.11- 3.51 (m, 6 H), 3.78 (br s, 2 H), 4.28 (br s, 2 H), 5.09 (s, 2 H), 6.93 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.07 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.53 (d, J = 7.9 Hz, 2 H), 8.01 (d, J = 7.9 Hz, 2 H), 8.19 (s, 1 H).
1-102	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.79(t, J=7.4Hz, 6H), 0.99-1.14(m, 4H), 1.37-1.59(m, 4H), 2.32(s, 3H), 2.40-2.49(m, 1H), 3.50(s, 2H), 4.21(s, 2H), 4.28(s, 2H), 5.07(s, 2H), 6.92(d, J=8.8Hz, 2H), 7.06(d, J=8.4Hz, 2H), 7.20(brs, 1H), 7.49(d, J=8.4Hz, 2H), 7.94(d, J=8.4Hz, 2H), 8.06(s, 1H), 12.57(brs, 1H),

表 17-21

实施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
1-103	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.77(t, J = 7.3 Hz, 6H), 0.88-1.17(m, 15H), 1.32-1.51(m, 4H), 1.56-1.72(m, 5H), 2.28-2.39(m, 1H), 3.38(d, J = 7.3 Hz, 2H), 4.22(sep, J = 6.6 Hz, 1H), 4.36(s, 2H), 4.90(s, 2H), 6.61(d, J = 8.8 Hz, 2H), 6.88(d, J = 8.8 Hz, 2H), 7.34(d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.60(d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.82-7.87(m, 4H), 7.94(s, 1H), 8.88(brs, 1H), 12.54(brs, 1H)
1-104	DMSO(NaOD)-d ₆ , 400MHz	0.77(t, J = 7.3 Hz, 6H), 0.77(d, J = 6.7 Hz, 6H), 1.02-1.11(m, 4H), 1.14(d, J = 6.5 Hz, 6H), 1.34-1.50(m, 4H), 1.94-2.01(m, 1H), 2.29-2.37(m, 1H), 3.31-3.38(m, 2H), 4.21(sep, J = 6.5 Hz, 1H), 4.36(s, 2H), 4.88(s, 2H), 6.59(d, J = 8.6 Hz, 2H), 6.87(d, J = 8.6 Hz, 2H), 7.33(d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.38(d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.75(d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.86(d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.93(s, 1H)
1-105	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.78(t, J=7.1Hz, 6H), 0.92(d, J=6.3Hz, 6H), 1.00-1.13(m, 4H), 1.31-1.55(m, 4H), 1.96-2.10(m, 1H), 2.26-2.39(m, 1H), 3.08(s, 3H), 3.23(d, J=7.5Hz, 2H), 3.78(s, 2H), 4.57(s, 2H), 4.63(s, 2H), 6.59(d, J=9.0Hz, 2H), 6.88(d, J=8.7Hz, 2H), 7.09-7.14(m, 1H), 7.24-7.36(m, 6H), 7.83(d, J=8.1Hz, 2H), 7.93(s, 1H)
1-106	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.78(t, J=7.4Hz, 6H), 0.92(d, J=6.4Hz, 6H), 1.02-1.12(m, 4H), 1.34-1.51(m, 4H), 2.00-2.07(m, 1H), 2.30-2.36(m, 1H), 3.22(d, J=6.4Hz, 2H), 3.42(brs, 2H), 3.51(s, 2H), 4.22(s, 2H), 4.56(s, 2H), 6.57(d, J=8.4Hz, 2H), 6.87(d, J=8.4Hz, 2H), 6.99-7.04(m, 1H), 7.22(d, J=8.0Hz, 2H), 7.26(dd, J=8.8, 7.2Hz, 2H), 7.65(d, J=8.8Hz, 2H), 7.82(d, J=8.8Hz, 2H), 7.93(s, 1H)
1-107	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.78(t, J=7.2Hz, 6H), 0.92(d, J=6.4Hz, 6H), 1.01-1.12(m, 4H), 1.17(d, J=6.8Hz, 6H), 1.33-1.51(m, 4H), 1.98-2.09(m, 1H), 2.28-2.37(m, 1H), 2.82(q, J=9.2Hz, 1H), 3.22(d, J=7.6Hz, 2H), 3.54(s, 2H), 3.59(s, 2H), 4.25(s, 2H), 4.56(s, 2H), 6.57(d, J=8.8Hz, 2H), 6.87(d, J=8.4Hz, 2H), 7.14(d, J=8.4Hz, 2H), 7.22(d, J=8.0Hz, 2H), 7.49(d, J=8.8Hz, 2H), 7.83(d, J=8.4Hz, 2H), 7.95(s, 1H)

表 17-22

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
1-108	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.78 (t, J = 7.4 Hz, 6 H), 0.98- 1.14 (m, 4 H), 1.16 (d, J = 6.4 Hz, 6 H), 1.30- 1.55 (m, 4 H), 2.15 (s, 3 H), 2.25- 2.40 (m, 1 H), 4.15- 4.30 (m, 1 H), 4.37 (s, 2 H), 5.64 (s, 2 H), 6.61 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 6.89 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.36 (d, J = 8.1 Hz, 2 H), 7.57 (dd, J = 8.6, 1.9 Hz, 1 H), 7.78 (d, J = 1.9 Hz, 1 H), 7.91 (d, J = 8.1 Hz, 2 H), 8.09 (s, 1 H), 8.14 (d, J = 8.6 Hz, 1 H), 9.43 (s, 1 H), 12.72 (br s, 1 H).
1-109	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.78 (t, J = 7.3 Hz, 6 H), 1.00- 1.15 (m, 4 H), 1.16 (d, J = 6.4 Hz, 6 H), 1.30- 1.53 (m, 4 H), 2.30 (s, 6 H), 2.25- 2.40 (m, 1 H), 3.14 (s, 2 H), 4.15- 4.30 (m, 1 H), 4.37 (s, 2 H), 5.67 (s, 2 H), 6.61 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 6.88 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.36 (d, J = 8.5 Hz, 2 H), 7.65 (dd, J = 8.5, 1.5 Hz, 1 H), 7.78 (d, J = 1.5 Hz, 1 H), 7.91 (d, J = 8.5 Hz, 2 H), 8.14 (s, 1 H), 8.41 (d, J = 8.5 Hz, 1 H), 10.00 (s, 1 H), 12.81 (br s, 1 H).
1-110	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.68(t, J=7.3Hz, 6H), 1.16(d, J=6.4Hz, 6H), 1.31-1.48(m, 2H), 1.49-1.64(m, 2H), 2.06-2.19(m, 1H), 3.58(s, 2H), 4.15-4.40(m, 7H), 6.62(d, J=8.7Hz, 2H), 6.88(d, J=8.7Hz, 2H), 7.14-7.22(m, 2H), 7.33(d, J=8.3Hz, 2H), 7.50-7.58(m, 2H), 7.84(d, J=8.3Hz, 2H), 7.95(s, 1H)
1-111	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79(t, J=7.2Hz, 6H), 0.97-1.18(m, 4H), 1.36-1.61(m, 4H), 2.39-2.54(m, 1H), 3.59(s, 2H), 4.20(s, 2H), 4.33(s, 2H), 5.08(s, 2H), 6.93(d, J=8.6Hz, 2H), 7.07(d, J=8.7Hz, 2H), 7.12-7.21(m, 2H), 7.44-7.58(m, 4H), 7.95(d, J=8.3Hz, 2H), 8.05(s, 1H)
1-112	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.78 (t, J = 7.4 Hz, 6 H), 1.00- 1.15 (m, 4 H), 1.16 (d, J = 6.4 Hz, 6 H), 1.30- 1.55 (m, 4 H), 2.25- 2.40 (m, 1 H), 3.08 (s, 3 H), 4.15- 4.30 (m, 1 H), 4.37 (s, 2 H), 5.62 (s, 2 H), 6.61 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 6.89 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.36 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 7.45 (d, J = 8.3 Hz, 1 H), 7.60 (dd, J = 8.3, 1.9 Hz, 1 H), 7.81 (d, J = 1.9 Hz, 1 H), 7.91 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 8.10 (s, 1 H), 9.33 (br s, 1 H), 12.91 (br s, 1 H).

表 17-23

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
1-113	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.78 (t, J = 7.4 Hz, 6 H), 0.98- 1.15 (m, 1 H), 1.11 (d, J = 6.8 Hz, 6 H), 1.16 (d, J = 6.4 Hz, 6 H), 1.30- 1.55 (m, 1 H), 2.25- 2.40 (m, 1 H), 2.75- 2.90 (m, 1 H), 4.15- 4.30 (m, 1 H), 4.37 (s, 2 H), 5.63 (s, 2 H), 6.61 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 6.89 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.36 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 7.59 (dd, J = 8.4, 1.5 Hz, 1 H), 7.78 (d, J = 1.5 Hz, 1 H), 7.90 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 8.09 (s, 1 H), 8.13 (d, J = 8.4 Hz, 1 H), 9.24 (s, 1 H), 12.77 (br s, 1 H).
1-114	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.68 (t, J = 7.3 Hz, 6 H), 1.16 (d, J = 6.4 Hz, 6 H), 1.32- 1.46 (m, 2 H), 1.48- 1.63 (m, 2 H), 2.05- 2.21 (m, 1 H), 4.23 (sept, J = 6.8 Hz, 1 H), 4.37 (s, 2 H), 4.88 (s, 2 H), 5.47 (s, 2 H), 6.61 (d, J = 9.1 Hz, 2 H), 6.88 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.12 (d, J = 8.3 Hz, 1 H), 7.34 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 7.62 (dd, J = 8.3, 1.9 Hz, 1 H), 7.92 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 8.01 (s, 1 H), 8.18 (d, J = 1.9 Hz, 1 H), 12.84 (br s, 1 H).
1-115	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.68 (t, J = 7.3 Hz, 6 H), 1.15 (d, J = 6.4 Hz, 6 H), 1.32- 1.47 (m, 2 H), 1.48- 1.64 (m, 2 H), 2.07- 2.13 (m, 1 H), 4.22 (sept, J = 6.6 Hz, 1 H), 4.37 (s, 2 H), 4.84 (s, 2 H), 5.49 (s, 2 H), 6.61 (d, J = 8.6 Hz, 2 H), 6.88 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.10 (t, J = 8.1 Hz, 1 H), 7.34 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 7.38 (dd, J = 7.9, 1.5 Hz, 1 H), 7.52 (dd, J = 8.1, 1.3 Hz, 1 H), 7.85 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 7.99 (s, 1 H), 12.91 (br s, 1 H).
1-116	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.77(t, J=7.3Hz, 6H), 1.01-1.10(m, 4H), 1.16(d, J=6.6Hz, 6H), 1.32-1.50(m, 4H), 2.29-2.38(m, 1H), 3.17(s, 3H), 4.02(s, 2H), 4.18-4.26(m, 1H), 4.37(s, 2H), 4.80(s, 2H), 6.61(d, J=8.8Hz, 2H), 6.88(d, J=8.8Hz, 2H), 7.25-7.43(m, 7H), 7.87(d, J=8.4Hz, 2H), 8.02(s, 1H), 12.96(brs, 1H)

表 17-24

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
1-117	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.77(t, J = 7.3 Hz, 6H), 1.00-1.14(m, 4H), 1.15(d, J = 6.6 Hz, 6H), 1.16(d, J = 6.6 Hz, 6H), 1.32-1.52(m, 4H), 2.27-2.39(m, 1H), 2.82(sep, J = 6.6 Hz, 1H), 3.51(brs, 2H), 3.55(brs, 2H), 4.17-4.28(m, 3H), 4.36(s, 2H), 6.60(d, J = 8.8 Hz, 2H), 6.88(d, J = 8.8 Hz, 2H), 7.15(d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.32(d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.52(d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.85(d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.95(s, 1H)
1-118	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.78(t, J = 7.3 Hz, 6H), 1.02-1.12(m, 4H), 1.15(d, J = 6.5 Hz, 6H), 1.34-1.51(m, 4H), 2.18(s, 6H), 2.30-2.37(m, 1H), 3.54(s, 2H), 3.60(s, 2H), 4.21(sep, J = 6.5 Hz, 1H), 4.25(s, 2H), 4.35(s, 2H), 6.59(d, J = 8.6 Hz, 2H), 6.66(s, 1H), 6.87(d, J = 8.6 Hz, 2H), 7.20(s, 2H), 7.31(d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.84(d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.95(s, 1H), 9.97(brs, 1H), 12.70(brs, 1H)
1-119	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.77(t, J = 7.3 Hz, 6H), 1.02-1.11(m, 4H), 1.15(d, J = 6.5 Hz, 6H), 1.30-1.50(m, 4H), 2.29-2.37(m, 1H), 2.83(s, 6H), 3.44(s, 2H), 3.52(s, 2H), 3.62(s, 2H), 4.21(sep, J = 6.5 Hz, 1H), 4.25(s, 2H), 4.35(s, 2H), 6.59(d, J = 8.6 Hz, 2H), 6.66(d, J = 9.0 Hz, 2H), 6.87(d, J = 8.6 Hz, 2H), 7.31(d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.39(d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.84(d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.95(s, 1H), 9.68(s, 1H), 12.61(brs, 1H)
1-120	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.77(t, J = 7.3 Hz, 6H), 1.02-1.11(m, 4H), 1.15(d, J = 6.5 Hz, 6H), 1.34-1.51(m, 4H), 2.29-2.37(m, 1H), 3.44(s, 2H), 3.54(s, 2H), 4.18-4.25(m, 3H), 4.31(d, J = 6.0 Hz, 2H), 4.35(s, 2H), 6.59(d, J = 8.6 Hz, 2H), 6.87(d, J = 8.6 Hz, 2H), 7.17-7.28(m, 5H), 7.31(d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.83(d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.94(s, 1H), 8.40(t, J = 6.0 Hz, 1H), 12.59(brs, 1H)
1-121	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.77(t, J = 7.3 Hz, 6H), 1.02-1.11(m, 4H), 1.15(d, J = 6.5 Hz, 6H), 1.34-1.50(m, 4H), 2.29-2.37(m, 1H), 3.29-3.58(m, 10H), 3.67(s, 2H), 4.19(s, 2H), 4.21(sep, J = 6.5 Hz, 1H), 4.35(s, 2H), 6.59(d, J = 8.6 Hz, 2H), 6.87(d, J = 8.6 Hz, 2H), 7.32(d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.84(d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.94(s, 1H), 12.54(brs, 1H)

表 17-25

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
1-122	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.68(t, J=7.3Hz, 6H), 1.16(d, J=6.4Hz, 6H), 1.32-1.61(m, 4H), 2.05-2.17(m, 1H), 3.13(t, J=5.8Hz, 2H), 3.55(s, 2H), 4.09(t, J=5.8Hz, 2H), 4.17-4.30(m, 3H), 4.36(s, 2H), 6.62(d, J=8.6Hz, 2H), 6.87-6.93(m, 5H), 7.25(t, J=7.9Hz, 2H), 7.33(d, J=8.6Hz, 2H), 7.85(d, J=8.3Hz, 2H), 7.92(s, 1H)
1-123	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.67(t, J=7.4Hz, 6H), 1.14(d, J=6.4Hz, 6H), 1.31-1.62(m, 4H), 2.05-2.18(m, 1H), 2.90(t, J=6.4Hz, 2H), 3.13(t, J=6.4Hz, 2H), 3.32(s, 2H), 4.15-4.28(m, 3H), 4.34(s, 2H), 6.47-6.73(m, 5H), 6.87(d, J=8.6Hz, 2H), 7.05(t, J=7.9Hz, 2H), 7.31(d, J=8.3Hz, 2H), 7.83(d, J=7.9Hz, 2H), 7.91(s, 1H)
1-124	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.69 (t, J = 7.17 Hz, 6H), 1.16 (d, J = 6.39 Hz, 6H), 1.33-1.45 (m, 2H), 1.48- 1.62 (m, 2H), 2.08- 2.18 (m, 1H), 3.04 (s, 3H), 4.23 (quint, J = 6.39 Hz, 1H), 4.37 (s, 2H), 4.63 (s, 2H), 4.84 (s, 2H), 6.63 (d, J = 8.67 Hz, 2H), 6.89 (d, J = 8.67 Hz, 2H), 6.94 (d, J = 9.78 Hz, 1H), 6.99 (dd, J = 9.78, 2.64 Hz, 1H), 7.12 (d, J = 2.64 Hz, 1H), 7.34 (d, J = 8.28 Hz, 2H), 7.87 (d, J = 8.28 Hz, 2H), 7.90 (s, 1H)
1-125	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.80 (t, J = 7.15 Hz, 3H), 0.98-1.14 (m, 4H), 1.41-1.57 (m, 4H), 2.31-2.41 (m, 1H), 3.05 (s, 3H), 4.64 (s, 2H), 4.86 (s, 2H), 5.08 (s, 2H), 6.92-6.97 (m, 4H), 7.06-7.12 (m, 2H), 7.51 (d, J = 8.24 Hz, 2H), 7.97 (d, J = 8.24 Hz, 2H), 7.99 (s, 1H)
1-126	DMSO-d ₆ , 300MHz	¹ HNMR(DMSO-d ₆ ,300MHz) δ 0.78 (t, J = 7.2 Hz, 6 H), 0.95- 1.15 (m, 4 H), 1.16 (d, J = 6.8 Hz, 6 H), 1.30- 1.55 (m, 4 H), 2.30- 2.40 (m, 1 H), 2.34 (s, 3 H), 3.27 (s, 2 H), 4.15- 4.30 (m, 1 H), 4.37 (s, 2 H), 5.67 (s, 2 H), 6.61 (d, J = 8.5 Hz, 2 H), 6.89 (d, J = 8.5 Hz, 2 H), 7.36 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 7.63 (dd, J = 8.5, 1.5 Hz, 1 H), 7.78 (d, J = 1.5 Hz, 1 H), 7.91 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 8.12 (s, 1 H), 8.43 (d, J = 8.5 Hz, 1 H).

表 17-26

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
1-127	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.79(t, J=7.2Hz, 6H), 1.01-1.14(m, 4H), 1.26(s, 9H), 1.37-1.57(m, 4H), 2.41-2.49(m, 1H), 3.42(s, 2H), 4.22(s, 2H), 4.28(s, 2H), 5.07(s, 2H), 6.92(d, J=8.8Hz, 2H), 7.06(d, J=8.8Hz, 2H), 7.16(s, 1H), 7.48(d, J=8.0Hz, 2H), 7.94(d, J=8.4Hz, 2H), 8.04(s, 1H)
1-128	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.80(t, J=7.4Hz, 6H), 1.00-1.17(m, 4H), 1.38-1.57(m, 4H), 2.41-2.52(m, 1H), 4.28(s, 2H), 4.92(s, 2H), 5.08(s, 2H), 6.65-6.72(m, 1H), 6.68(d, J=8.0Hz, 2H), 6.93(d, J=8.8Hz, 2H), 7.06(d, J=8.4Hz, 2H), 7.16(dd, J=7.2, 7.2Hz, 2H), 7.51(d, J=8.4Hz, 2H), 7.97(d, J=8.0Hz, 2H), 7.99(s, 1H), 12.74(brs, 1H)
1-129	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79 (t, J = 7.3 Hz, 6 H), 0.95- 1.20 (m, 4 H), 1.35- 1.60 (m, 4 H), 2.40- 2.53 (m, 1 H), 4.10 (s, 2 Hx0.4), 4.37 (s, 2Hx0.6), 4.80- 5.12 (m, 6H), 6.85- 6.98 (m, 5H), 7.07 (d, J = 8.6 Hz, 2Hx0.6), 7.04- 7.31 (m, 2H), 7.15- 7.31 (m, 2H), 7.51 (d, J = 7.9 Hz, 2Hx0.4), 7.96 (d, J = 8.3 Hz, 2Hx0.6), 7.97 (d, J = 7.9 Hz, 2Hx0.4), 8.06 (s, 1Hx0.6), 8.13 (s, 1Hx0.4), 12.73 (br s, 1Hx0.4), 13.07 (br s, 1Hx0.6).
1-130	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79 (t, J = 7.3 Hz, 6 H), 0.95- 1.20 (m, 4 H), 1.35- 1.60 (m, 4 H), 2.19 (s, 3 Hx0.4), 2.22 (s, 3 Hx0.6), 2.40- 2.53 (m, 1 H), 4.10 (s, 2 Hx0.4), 4.36 (s, 2 Hx0.6), 4.78 (s, 2 Hx0.6), 4.84 (s, 2 Hx0.6), 5.03 (s, 2 Hx0.4), 5.05 (s, 2 Hx0.4), 5.09 (s, 2 H), 6.75- 7.10 (m, 8 H), 7.51 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 7.96 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 8.06 (s, 1 Hx0.6), 8.12 (s, 1 Hx0.4), 12.73 (br s, 1 Hx0.4), 13.05 (br s, 1 Hx0.6).
1-131	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.61-0.69(m, 6H), 0.74-0.97(m, 4H), 1.18(d, J = 6.3 Hz, 3H), 1.30-1.50(m, 4H), 1.63(d, J = 6.0 Hz, 3H), 2.39-2.48(m, 1H), 3.56(s, 2H), 3.65(s, 2H), 4.03-4.14(m, 3H), 4.21(s, 2H), 4.60-4.68(m, 1H), 4.96-5.02(m, 1H), 7.14(d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.39(d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.55(d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.67(d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.99(s, 1H), 12.63(brs, 1H)

表 17-27

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
1-132	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.68(t, J = 7.3 Hz, 6H), 1.16(d, J = 6.6 Hz, 6H), 1.26(s, 9H), 1.32-1.47(m, 2H), 1.49-1.63(m, 2H), 2.08-2.17(m, 1H), 3.45(s, 2H), 4.19-4.29(m, 5H), 4.36(s, 2H), 6.62(d, J = 8.8 Hz, 2H), 6.88(d, J = 8.8 Hz, 2H), 7.17(s, 1H), 7.33(d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.85(d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.96(s, 1H)
1-133	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.77(t, J = 7.3 Hz, 6H), 1.01-1.13(m, 4H), 1.16(d, J = 6.2 Hz, 6H), 1.35-1.51(m, 4H), 2.29-2.38(m, 1H), 4.22(sep, J = 6.2 Hz, 1H), 4.37(s, 2H), 5.79(s, 2H), 6.61(d, J = 8.8 Hz, 2H), 6.89(d, J = 8.8 Hz, 2H), 7.19(d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.35(d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.74(d, J = 7.3 Hz, 2H), 7.89(d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.92-7.97(m, 1H), 8.05(s, 1H)
1-134	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79 (t, J = 7.3 Hz, 6 H), 0.95- 1.20 (m, 4 H), 1.35- 1.60 (m, 4 H), 2.40- 2.53 (m, 1 H), 4.10 (s, 2 Hx0.4), 4.23 (s, 2 Hx0.6), 4.29 (s, 2 Hx0.6), 4.41 (s, 2 Hx0.4), 4.52 (s, 2 Hx0.6), 4.54 (s, 2 Hx0.4), 4.84 (s, 2 Hx0.6), 4.97 (s, 2x0.4 H), 5.09 (s, 2 H), 6.94 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.07 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.25- 7.40 (m, 5 H), 7.45- 7.55 (m, 2 H), 7.92- 7.98 (m, 2 H), 8.06 (s, 1 Hx0.6), 8.08 (s, 1 Hx0.4), 12.80 (br s, 1 H).
1-135	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79 (t, J = 7.2 Hz, 6 H), 0.96- 1.21 (m, 4 H), 1.13 (d, J = 6.8 Hz, 6 Hx0.4), 1.16 (d, J = 7.1 Hz, 6 Hx0.6), 1.34- 1.62 (m, 4 H), 2.39- 2.54 (m, 1 H), 2.70- 2.89 (m, 1 H), 4.10 (s, 2 Hx0.4), 4.36 (s, 2 Hx0.6), 4.79 (s, 2 Hx0.6), 4.84 (s, 2 Hx0.6), 5.04 (s, 2 Hx0.4), 5.05 (s, 2 Hx0.4), 5.09 (s, 2 H), 6.77- 6.87 (m, 2 H), 6.90- 6.98 (m, 2 H), 7.02- 7.15 (m, 4 H), 7.51 (d, J = 8.1 Hz, 2 H), 7.97 (d, J = 8.1 Hz, 2 Hx0.6), 7.98 (d, J = 8.1 Hz, 2 Hx0.4), 8.06 (s, 1 Hx0.6), 8.13 (s, 1 Hx0.4), 12.75 (br.s, 1 Hx0.4), 13.01 (br.s, 1 Hx0.6).
1-136	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.80(t, J=8.2Hz, 6H), 0.99-1.16(m, 4H), 1.37-1.58(m, 4H), 2.20(s, 3H), 2.30(s, 3H), 2.41-2.52(m, 1H), 3.46(s, 2H), 4.12(s, 2H), 4.26(s, 2H), 5.07(s, 2H), 6.93(d, J=6.8Hz, 2H), 7.06(d, J=8.8Hz, 2H), 7.49(d, J=8.4Hz, 2H), 7.94(d, J=8.0Hz, 2H), 8.05(s, 1H), 12.65(brs, 1H),

表 17-28

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
1-137	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.79(t, J=7.2Hz, 6H), 0.99-1.15(m, 4H), 1.38-1.58(m, 4H), 2.40-2.52(m, 1H), 5.24(s, 2H), 5.56(s, 2H), 5.56(s, 2H), 6.94(d, J=7.6Hz, 2H), 7.07(d, J=8.0Hz, 2H), 7.17(brs, 1H), 7.48(brs, 1H), 7.80(s, 1H), 8.01(s, 1H), 8.37(s, 1H), 8.63(s, 1H)
1-138	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.77(t, J = 6.0Hz, 6H), 1.03-1.09(m, 4H), 1.18(d, J = 9.0Hz, 6H), 1.26(s, 9H), 1.38-1.45(m, 4H), 2.30-2.42(m, 1H), 3.54(s, 2H), 4.24(s, 2H), 4.25-4.30(m, 1H), 4.32(s, 2H), 4.50(s, 2H), 6.65(d, J = 9.0Hz, 2H), 6.90(d, J = 9.0Hz, 2H), 7.20(s, 1H), 7.38(d, J = 9.0Hz, 1H), 7.62(s, 1H), 7.73(d, J = 9.0Hz, 1H), 8.57(s, 1H)
1-139	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.77(t, J = 6.0Hz, 6H), 1.02-1.10(m, 4H), 1.18(d, J = 9.0Hz, 6H), 1.38-1.44(m, 4H), 2.30-2.36(m, 1H), 3.61(s, 2H), 4.19(s, 2H), 4.20-4.25(m, 1H), 4.36(s, 2H), 4.50(s, 2H), 6.65(d, J = 9.0Hz, 2H), 6.90(d, J = 9.0Hz, 2H), 7.13(m, 2H), 7.38(d, J = 9.0Hz, 1H), 7.53-7.56(m, 2H), 7.62(s, 1H), 7.73(d, J = 9.0Hz, 1H), 8.55(s, 1H)
1-140	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.78(t, J = 6.0Hz, 6H), 1.02(m, 4H), 1.19(d, J = 6.0Hz, 6H), 1.34-1.52(m, 4H), 2.30-2.38(m, 1H), 4.20(s, 2H), 4.25-4.27(m, 1H), 4.37(s, 2H), 6.66(d, J = 9.0Hz, 2H), 7.03(d, J = 6.0Hz, 2H), 7.16-7.20(m, 2H), 7.40-7.42(m, 1H), 7.56-7.59(m, 2H), 7.63(s, 1H), 7.74(d, J = 9.0Hz, 1H), 8.56(s, 1H)
1-141	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.79(t, J=7.2Hz, 6H), 0.99-1.14(m, 4H), 1.33(s, 9H), 1.37-1.57(m, 4H), 2.41-2.53(m, 1H), 3.43(s, 2H), 4.17(s, 2H), 4.27(s, 2H), 5.07(s, 2H), 6.92(d, J=8.4Hz, 2H), 7.06(d, J=8.4Hz, 2H), 7.41(s, 1H), 7.49(d, J=8.4Hz, 2H), 7.94(d, J=8.4Hz, 2H), 8.05(s, 1H)
1-142	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.76(t, J=7.2Hz, 6H), 0.99-1.09(m, 4H), 1.14(d, J=6.0Hz, 6H), 1.30-1.56(m, 10H), 2.25-2.38(m, 1H), 3.14(brs, 2H), 3.41(brs, 4H), 3.62(s, 2H), 4.12(s, 2H), 4.17-4.25(m, 1H), 4.34(s, 2H), 6.59(d, J=8.4Hz, 2H), 6.87(d, J=8.4Hz, 2H), 7.32(d, J=7.5Hz, 2H), 7.84(d, J=6.9Hz, 2H), 7.92(s, 1H)

表 17-29

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
1-143	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.80 (t, J = 7.3 Hz, 6 H), 0.98- 1.18 (m, 4 H), 1.35- 1.61 (m, 4 H), 2.35- 2.53 (m, 1 H), 3.18 (s, 3 H), 5.08 (s, 2 H), 5.22 (s, 2 H), 6.94 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.01 (d, J = 8.4 Hz, 1 H), 7.07 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.35 (d, J = 6.8 Hz, 1 H), 7.51 (d, J = 7.9 Hz, 2 H), 7.74 (dd, J = 8.4, 6.8 Hz, 1 H), 7.96 (d, J = 7.9 Hz, 2 H), 7.99 (s, 1 H), 12.60 (br s, 1 H).
1-144	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.77(t, J = 6.0Hz, 6H), 1.02-1.10(m,4H), 1.18(d,J = 9.0Hz, 6H), 1.38-1.48(m,4H), 2.30-2.35(m,1H), 3.40(s,2H), 4.14(s,2H), 4.22-4.28(m,1H), 4.50(s,1H), 6.65(d,J = 9.0Hz, 2H), 6.90(d,J = 9.0Hz, 2H), 7.38(d,J = 9.0Hz, 1H), 7.62(s,1H), 7.73(d,J = 9.0Hz, 1H), 7.89(m,1H), 8.52(s,1H)
1-145	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.61-0.83(m, 6H), 1.00-1.24(m, 6H), 1.35-1.65(m, 8H), 2.27-2.39(m, 1H), 3.19-3.34(m, 2H), 4.03-4.26(m, 2H), 4.36(brs, 1H), 4.61-4.72(m, 1H), 4.83(brs, 1H), 4.96-5.06(m, 1H), 6.62(brs, 2H), 6.88(brs, 2H), 7.17(brd, J=8.4Hz, 2H), 7.28-7.53(m, 3H), 7.69(brd, J=7.2Hz, 2H), 7.79-7.87(m, 1H), 7.91-7.99(m, 2H)
1-146	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.78(t, J=7.3Hz, 6H), 1.01-1.22(m, 4H), 1.16(d, J=6.6Hz, 6H), 1.32-1.52(m, 4H), 2.20(s, 3H), 2.28-2.38(m, 1H), 2.30(s, 3H), 3.48(s, 2H), 4.11(s, 2H), 4.18-4.28(m, 1H), 4.25(s, 2H), 4.36(s, 2H), 6.61(d, J=8.4Hz, 2H), 6.88(d, J=8.4Hz, 2H), 7.34(d, J=8.0Hz, 2H), 7.86(d, J=8.0Hz, 2H), 7.97(s, 1H), 12.57(brs, 1H)
1-147	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.79(t, J=7.4Hz, 6H), 0.99-1.14(m, 4H), 1.23(s, 9H), 1.37-1.56(m, 4H), 2.39-2.49(m, 1H), 3.48(s, 2H), 4.03(s, 2H), 4.23(s, 2H), 5.07(s, 2H), 6.72(s, 1H), 6.92(d, J=8.8Hz, 2H), 7.06(d, J=8.8Hz, 2H), 7.48(d, J=8.4Hz, 2H), 7.93(d, J=8.0Hz, 2H), 8.02(s, 1H)
1-148	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79(t, J=7.4Hz, 6H), 0.98-1.16(m, 4H), 1.35-1.60(m, 4H), 2.40-2.54(m, 1H), 3.65(s, 2H), 3.96(s, 3H), 4.36(s, 2H), 4.45(s, 2H), 5.07(s, 2H), 6.93(d, J=8.7Hz, 2H), 7.07(d, J=8.7Hz, 2H), 7.31-7.44(m, 2H), 7.47(d, J=8.3Hz, 2H), 7.64-7.77(m, 2H), 7.88(d, J=8.3Hz, 2H), 7.98(s, 1H)

表 17-30

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
1-149	DMSO-d ₆ +D ₂ O+NaHCO ₃ , 300MHz	0.78(t, J=7.4Hz, 6H), 0.87(d, J=6.4Hz, 6H), 0.99-1.13(m, 4H), 1.16(d, J=6.4Hz, 6H), 1.32-1.50(m, 4H), 1.78-1.90(m, 1H), 2.26-2.39(m, 1H), 3.08(s, 2H), 3.72(s, 2H), 3.82(d, J=6.4Hz, 2H), 4.16-4.26(m, 3H), 4.36(s, 2H), 6.60(d, J=8.7Hz, 2H), 6.88(d, J=8.7Hz, 2H), 7.32(d, J=8.3Hz, 2H), 7.84(d, J=8.3Hz, 2H), 7.89(s, 1H)
1-150	DMSO-d ₆ +D ₂ O+NaHCO ₃ , 300MHz	0.78(t, J=7.2Hz, 6H), 0.86(t, J=7.4Hz, 3H), 0.98-1.12(m, 4H), 1.16(d, J=6.4Hz, 6H), 1.30-1.63(m, 6H), 2.27-2.40(m, 1H), 3.98(t, J=6.6Hz, 2H), 4.17-4.25(m, 3H), 4.35(s, 2H), 6.60(d, J=8.6Hz, 2H), 6.88(d, J=8.6Hz, 2H), 7.33(d, J=8.3Hz, 2H), 7.84(d, J=8.3Hz, 2H), 7.88(s, 1H)
1-151	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.80(t, J=7.2Hz, 6H), 1.01-1.15(m, 4H), 1.37-1.58(m, 4H), 1.75-2.16(m, 5H), 2.43-2.46(m, 1H), 3.11(brs, 2H), 3.55(brs, 2H), 3.86(brs, 1H), 5.10(s, 2H), 6.94(d, J=8.7Hz, 2H), 7.08(d, J=8.7Hz, 2H), 7.54(d, J=9.0Hz, 2H), 8.01(d, J=9.0Hz, 2H), 8.32(brs, 1H), 11.54(brs, 1H), 12.45(brs, 1H)
1-152	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.69(t, J=7.3Hz, 6H), 1.16(d, J=6.8Hz, 6H), 1.33-1.65(m, 6H), 1.76-1.87(m, 2H), 2.08-2.30(m, 4H), 2.83-2.92(m, 2H), 3.84(s, 2H), 4.18-4.27(m, 1H), 4.36(s, 2H), 6.62(d, J=8.7Hz, 2H), 6.88(d, J=8.7Hz, 2H), 7.34(d, J=8.3Hz, 2H), 7.86(d, J=7.9Hz, 2H), 7.95(s, 1H), 12.15(s, 1H)
1-153	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.80(t, J=7.2Hz, 6H), 1.01-1.18(m, 4H), 1.38-1.58(m, 4H), 2.42-2.48(m, 1H), 2.70(brs, 4H), 3.35(brs, 4H), 3.96(s, 2H), 5.09(s, 2H), 6.94(d, J=9.1Hz, 2H), 6.98(d, J=9.4Hz, 2H), 7.08(d, J=8.7Hz, 2H), 7.51(d, J=8.3Hz, 2H), 7.78(d, J=9.0Hz, 2H), 7.98(d, J=8.3Hz, 2H), 8.08(s, 1H), 12.29(brs, 1H)

表 17-31

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
1-154	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.69(t, J=7.4Hz, 6H), 1.16(d, J=6.4Hz, 6H), 1.34-1.62(m, 4H), 2.08-2.18(m, 1H), 2.68(brs, 4H), 3.36(brs, 4H), 3.94(s, 2H), 4.18-4.27(m, 1H), 4.37(s, 2H), 6.62(d, J=8.6Hz, 2H), 6.89(d, J=8.6Hz, 2H), 6.97(d, J=9.0Hz, 2H), 7.34(d, J=7.9Hz, 2H), 7.77(d, J=9.0Hz, 2H), 7.87(d, J=8.3Hz, 2H), 7.98(s, 1H), 12.29(brs, 1H)
1-155	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.81(t, J=7.3Hz, 6H), 1.00-1.19(m, 4H), 1.43-1.59(m, 4H), 2.53-2.61(m, 1H), 2.81(brs, 4H), 3.13(brs, 4H), 4.01(s, 2H), 5.09(s, 2H), 7.07(d, J=12.7Hz, 2H), 7.19(d, J=8.3Hz, 2H), 7.35-7.42(m, 3H), 7.62-7.74(m, 2H), 7.89(d, J=9.0Hz, 2H), 7.92(s, 1H), 7.98-8.01(m, 1H), 12.81(brs, 1H)
1-156	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.81(t, J=7.2Hz, 6H), 1.02-1.18(m, 4H), 1.45-1.61(m, 4H), 2.55-2.60(m, 1H), 2.72(brs, 4H), 3.23(brs, 4H), 3.95(s, 2H), 5.09(s, 2H), 7.08(d, J=9.1Hz, 2H), 7.16-7.23(m, 3H), 7.31(d, J=7.5Hz, 2H), 7.34-7.42(m, 2H), 7.47(brs, 1H), 7.89(d, J=9.0Hz, 2H), 7.90(brs, 1H), 12.84(brs, 1H)
1-157	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.76(t, J = 7.3Hz, 6H), 0.93(m,4H), 1.36(m,4H), 5.45(s,2H), 5.60(s,2H), 7.09(m,9H), 7.57(d, J = 7.3Hz, 1H), 7.85(s,1H), 7.93(d, J = 8.4Hz, 2H), 8.06(s,1H), 8.11(d, J = 8.1Hz, 1H)
1-158	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.74(t, J = 7.5Hz, 6H), 0.98(m,4H), 1.06(d, J = 7.2Hz, 6H), 1.48(m,4H), 2.7(m,1H), 5.59(s,2H), 5.92(s,2H), 6.99(m,6H), 7.37(s,1H), 7.42(d, J = 8.3Hz, 1H), 7.80(d, J = 8.7Hz, 2H), 8.41(s,1H)
1-159	CDCl ₃ , 300MHz	0.82(t, J = 7.2Hz, 6H), 1.09(m,4H), 1.53(s,3H), 1.54(m,4H), 2.53(m,1H), 0.82(s,1H), 6.99(d, J = 6.8Hz, 1H), 7.14(m,1H), 7.25(s,3H), 7.30(d, J = 8.3Hz, 1H), 7.38(s,1H), 8.04(brs,1H)

表 17-32

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
1-160	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.80(t, J=7.1Hz, 6H), 0.99-1.16(m, 4H), 1.38-1.59(m, 4H), 2.40-2.50(m, 1H), 2.82-2.98(m, 4H), 3.84(s, 2H), 4.09(s, 2H), 5.09(s, 2H), 6.94(d, J=8.8Hz, 2H), 7.08(d, J=8.4Hz, 2H), 7.26(d, J=8.1Hz, 1H), 7.52(d, J=8.4Hz, 2H), 7.66(s, 1H), 7.72(d, J=8.1Hz, 1H), 7.99(d, J=8.1Hz, 2H), 8.08(s, 1H), 12.79(s, 1H)
1-161	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.81(t, J=7.3Hz, 6H), 1.00-1.18(m, 4H), 1.43-1.60(m, 4H), 1.64-1.83(m, 4H), 2.29(t, J=11.1Hz, 3H), 2.55-2.67(m, 1H), 3.06(d, J=11.3Hz, 2H), 3.90(s, 2H), 5.08(s, 2H), 7.07(d, J=8.6Hz, 2H), 7.19(d, J=8.3Hz, 2H), 7.37-7.41(m, 4H), 7.86-7.89(m, 5H)
1-162	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.81(t, J=7.3Hz, 6H), 1.02-1.19(m, 4H), 1.43-1.60(m, 4H), 1.66-1.86(m, 4H), 2.30(t, J=10.5Hz, 2H), 2.53-2.68(m, 2H), 3.06(d, J=11.7Hz, 2H), 3.91(s, 2H), 5.09(s, 2H), 7.07(d, J=8.6Hz, 2H), 7.19(d, J=7.9Hz, 2H), 7.37-7.46(m, 3H), 7.54(d, J=7.9Hz, 1H), 7.78(d, J=7.5Hz, 1H), 7.83(s, 1H), 7.87-7.90(m, 3H), 12.93(brs, 1H)
1-163	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.80 (t, J = 7.3 Hz, 6 H), 0.98- 1.18 (m, 4 H), 1.36- 1.60 (m, 4 H), 2.39- 2.53 (m, 1 H), 4.85 (d, J = 6.3 Hz, 2 H), 5.09 (s, 2 H), 6.94 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.07 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.51 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 7.97 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 8.01 (s, 1 H), 8.20 (dd, J = 8.1, .9 Hz, 1 H), 8.48 (dd, J = 8.1, 2.1 Hz, 1 H), 9.14 (dd, J = 2.1, .9 Hz, 1 H), 9.88 (t, J = 6.3 Hz, 1 H), 13.74 (br s, 1 H).
1-164	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.81(t, J=7.2Hz, 6H), 1.03-1.17(m, 4H), 1.48-1.59(m, 4H), 1.70-1.80(m, 4H), 2.19-2.30(m, 2H), 2.48-2.59(m, 2H), 3.06(d, J=10.9Hz, 2H), 3.90(s, 2H), 5.08(s, 2H), 7.07(d, J=9.0Hz, 2H), 7.19(d, J=8.3Hz, 2H), 7.24-7.31(m, 1H), 7.38(d, J=8.3Hz, 2H), 7.45-7.53(m, 2H), 7.66(d, J=8.3Hz, 1H), 7.87-7.89(m, 3H)
1-165	CDCl ₃ , 300MHz	0.80(t, J = 7.2Hz, 6H), 1.06(m, 4H), 1.43(m, 4H), 2(m, 4H), 2.42(m, 2H), 2.64(m, 1H), 3.17(m, 2H), 4.17(s, 2H), 5.31(s, 2H), 7.02(m, 4H), 7.21(m, 5H), 7.33(m, 2H), 7.69(s, 1H), 7.99(m, 1H)

表 17-33

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
1-166	CDCl ₃ , 300MHz	0.80(t, J = 7.5Hz, 6H), 1.03(m,4H), 1.43(m,4H), 2.41(m,1H), 3.10-3.25(m,4H), 4.12(m,2H), 4.32(m,2H), 5.32(s,2H), 7.02-7.09(m,4H), 7.21(m,6H), 7.34(m,2H), 7.72(s,1H), 7.77(s,1H), 7.85(d, J = 6.4Hz, 1H), 8.01(t, J = 3.0Hz, 1H)
1-167	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.77(t, J = 7.3Hz, 6H), 1(m,4H), 1.42(m,4H), 4.68(s,2H), 5.44(s,2H), 6.86(m,1H), 7.1(m,9H), 7.56(d, J = 7.7Hz, 1H), 7.65(s,1H), 8.04(s,1H), 8.10(d, J = 7.3Hz, 1H)
1-168	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.80 (t, J = 7.2 Hz, 6 H), 0.98- 1.19 (m, 4 H), 1.36- 1.62 (m, 4 H), 2.39- 2.53 (m, 1 H), 3.07- 3.32 (m, 2 H), 3.66- 4.10 (m, 2 H), 5.02- 5.12 (m, 4 H), 6.94 (d, J = 8.5 Hz, 2 H), 7.08 (d, J = 8.5 Hz, 2 H), 7.48- 7.58 (m, 2 H), 7.84 (d, J = 7.9 Hz, 1 Hx0.5), 7.89 (d, J = 8.3 Hz, 1 Hx0.5), 7.92- 8.14 (m, 5 H), 8.12 (s, 1 Hx0.5), 8.13 (s, 1 Hx0.5), 8.39- 8.48 (m, 1 H), 9.04 (d, J = 1.5 Hz, 1 Hx0.5), 9.15 (d, J = 1.5 Hz, 1 Hx0.5), 13.67 (br s, 1 H).
1-169	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.72(t, J=7.4Hz, 6H), 0.87-1.08(m, 4H), 1.30-1.53(m, 4H), 2.36-2.47(m, 1H), 2.78-2.92(m, 4H), 3.80(s, 2H), 4.12(s, 2H), 6.05(s, 2H), 6.98-7.09(m, 4H), 7.20-7.30(m, 3H), 7.56-7.75(m, 4H), 8.40(s, 1H), 12.77(s, 1H)
1-170	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.73(t, J=7.2Hz, 6H), 0.89-1.09(m, 4H), 1.31-1.54(m, 4H), 2.37-2.50(m, 1H), 2.69(brs, 4H), 3.19(brs, 4H), 4.00(s, 2H), 6.04(s, 2H), 7.05(s, 4H), 7.16-7.41(m, 5H), 7.46(brs, 1H), 7.57-7.74(m, 2H), 8.42(s, 1H), 12.71(brs, 1H)
1-171	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.70(t, J=6.8Hz, 6H), 0.85-1.07(m, 4H), 1.30-1.51(m, 4H), 1.57-1.79(m, 4H), 2.20-2.63(m, 4H), 2.94-3.05(m, 2H), 3.96(s, 2H), 6.04(s, 2H), 7.03(s, 4H), 7.24(brs, 2H), 7.35(d, J=7.5Hz, 2H), 7.56-7.73(m, 2H), 7.87(d, J=7.5Hz, 2H), 8.39(s, 1H)

表 17-34

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
1-172	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.75(t, J = 7.5Hz, 6H), 0.96(m, 4H), 1.4(m, 4H), 2.72(m, 4H), 3.22(m, 4H), 3.95(s, 2H), 5.42(s, 2H), 7.07-7.20(m, 7H), 7.31(m, 1H), 7.45(s, 1H), 7.54(d, J = 7.2Hz, 1H), 7.73(s, 1H), 8.09(d, J = 6.0Hz, 1H)
1-173	DMSO-d ₆ , 300MHz	1.64-1.85(m, 4H), 2.30(t, J=10.4Hz, 2H), 2.58-2.68(m, 1H), 3.06(d, J=11.7Hz, 2H), 3.90(s, 2H), 5.17(s, 2H), 7.08(d, J=9.0Hz, 2H), 7.40-7.54(m, 3H), 7.67(d, J=8.3Hz, 1H), 7.75(d, J=2.3Hz, 1H), 7.76-7.80(m, 1H), 7.81-7.84(m, 1H), 7.86-7.91(m, 3H)
1-174	DMSO-d ₆ , 300MHz	1.72-2.12(m, 4H), 2.26-2.46(m, 2H), 2.80-3.03(m, 1H), 3.54-3.80(m, 2H), 4.82(s, 2H), 5.38(s, 2H), 7.16(d, J=8.3Hz, 2H), 7.42-7.53(m, 2H), 7.77-7.86(m, 2H), 7.96(d, J=7.9Hz, 2H), 8.11-8.19(m, 3H), 12.94(brs, 1H)
1-175	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.93(t, J=7.4Hz, 3H), 1.37-1.49(m, 2H), 1.65-1.85(m, 6H), 2.25-2.35(m, 2H), 3.02-3.10(m, 3H), 3.90(s, 2H), 3.97(t, J=6.4Hz, 2H), 5.05(s, 2H), 6.94(d, J=8.7Hz, 2H), 7.05(d, J=9.0Hz, 2H), 7.36-7.44(m, 3H), 7.49-7.54(m, 1H), 7.75-7.88(m, 5H)
1-176	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.80(t, J=7.3Hz, 6H), 1.02-1.13(m, 4H), 1.40-1.57(m, 4H), 2.21(s, 3H), 2.42-2.51(m, 1H), 5.08(s, 2H), 6.00(s, 2H), 6.72(s, 1H), 6.93(d, J=8.6Hz, 2H), 7.06(d, J=8.6Hz, 2H), 7.50(d, J=8.3Hz, 2H), 7.93(d, J=8.3Hz, 2H), 8.03(s, 1H), 13.52(brs, 1H)
1-177	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.79(t, J=7.3Hz, 6H), 1.02-1.13(m, 4H), 1.39-1.56(m, 4H), 2.39(s, 3H), 2.42-2.52(m, 1H), 5.08(s, 2H), 5.77(s, 2H), 6.56(s, 1H), 6.92(d, J=8.6Hz, 2H), 7.06(d, J=8.6Hz, 2H), 7.51(d, J=8.1Hz, 2H), 7.94(d, J=8.1Hz, 2H), 8.10(s, 1H), 12.67(brs, 1H)
1-178	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.80(t, J=7.3Hz, 6H), 1.01-1.15(m, 4H), 1.36(s, 9H), 1.40-1.59(m, 4H), 2.41-2.53(m, 1H), 5.09(s, 2H), 5.90(s, 2H), 6.54(s, 1H), 6.94(d, J=8.4Hz, 2H), 7.07(d, J=8.4Hz, 2H), 7.52(d, J=8.1Hz, 2H), 7.96(d, J=8.1Hz, 2H), 8.09(s, 1H), 12.74(brs, 1H)

表 17-35

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
1-179	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.80(t, J=7.1Hz, 6H), 1.02-1.15(m, 4H), 1.28(s, 9H), 1.38-1.56(m, 4H), 2.42-2.55(m, 1H), 5.09(s, 2H), 6.04(s, 2H), 6.81(s, 1H), 6.94(d, J=8.8Hz, 2H), 7.08(d, J=8.8Hz, 2H), 7.51(d, J=8.4Hz, 2H), 7.95(d, J=8.4Hz, 2H), 8.03(s, 1H)
1-180	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.76(t, J = 7.3Hz, 6H), 0.99(m,4H), 1.42(m,4H), 1.9(m,2H), 2.44(m,1H), 3.27(m,3H), 3.60(t, J = 8.1Hz, 1H), 4.04(d, J = 15.4Hz, 1H), 4.26(m,2H), 5.43(s,2H), 7.09(m,7H), 7.54(d, J = 7.0Hz, 1H), 7.70(s,1H), 8.01(s,1H), 8.11(d, J = 7.3Hz, 1H)
1-181	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.77(t, J=7.3Hz, 6H), 1.00-1.11(m, 4H), 1.26-1.54(m, 6H), 1.77(brd, J=14.8Hz, 2H), 1.96-2.04(m, 1H), 2.39-2.45(m, 1H), 2.80(brt, J=12.3Hz, 2H), 2.98(d, J=6.9Hz, 2H), 3.87(brd, J=13.0Hz, 2H), 5.05(s, 2H), 6.90(d, J=8.6Hz, 4H), 7.04(d, J=8.6Hz, 2H), 7.47(d, J=8.1Hz, 2H), 7.70(d, J=9.0Hz, 2H), 7.93(d, J=8.1Hz, 2H), 7.95(s, 1H), 12.16(brs, 1H)
1-182	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.76(t, J = 7.3Hz, 6H), 0.97-1.09(m,4H), 1.39-1.52(m,4H), 2.44-2.50(m,1H), 5.44(s,2H), 5.95(s,2H), 7.10(d, J = 8.4Hz, 2H), 7.17(d, J = 8.4Hz, 2H), 7.21-7.28(m,3H), 7.54(d, J = 7.0Hz, 1H), 7.68(d, J = 7.0Hz, 1H), 7.70(s,1H), 8.03(s,1H), 8.04-8.10(m,2H), 8.29(s,1H)
1-183	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.74(t, J = 7.1Hz, 6H), 0.95-1.10(m,4H), 1.36-1.57(m,6H), 1.77-1.80(m,2H), 2.11-2.18(m,3H), 2.40-2.43(m,1H), 2.80-2.84(m,2H), 3.80(s,2H), 5.24(s,2H), 6.63(s,1H), 6.77(d, J = 7.9Hz, 2H), 6.97(d, J = 7.9Hz, 2H), 7.10-7.20(m,2H), 7.32-7.44(m,6H), 8.16(dd, J = 1.9, 9.0Hz, 1H)
1-184	DMSO-d ₆ , 300MHz	1.63-1.85(m, 4H), 2.25-2.35(m, 2H), 2.52(s, 3H), 2.59-2.74(m, 1H), 3.06(d, J=12.8Hz, 2H), 3.90(s, 2H), 5.24(s, 2H), 7.09(d, J=9.0Hz, 2H), 7.42(t, J=7.7Hz, 1H), 7.51-7.58(m, 2H), 7.70-7.83(m, 3H), 7.86-7.92(m, 3H), 8.09(d, J=1.9Hz, 1H)

表 17-36

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
1-185	DMSO-d ₆ , 300MHz	1.10(d, J=6.8Hz, 6H), 2.71-2.92(m, 5H), 3.11(brs, 4H), 3.71-3.82(m, 6H), 4.11(s, 2H), 6.00(s, 2H), 6.96-7.12(m, 6H), 7.24(d, J=7.9Hz, 1H), 7.53(d, J=9.1Hz, 1H), 7.61(s, 1H), 7.71(d, J=8.3Hz, 1H), 8.29(s, 1H), 12.78(brs, 1H)
1-186	DMSO-d ₆ , 300MHz	1.11(d, J=6.4Hz, 6H), 2.66(brs, 4H), 2.72-2.83(m, 1H), 3.07-3.22(m, 8H), 3.75(brs, 4H), 3.98(s, 2H), 6.00(s, 2H), 6.95-7.23(m, 6H), 7.28-7.41(m, 3H), 7.45(s, 1H), 7.53(d, J=9.1Hz, 1H), 8.30(s, 1H), 12.82(brs, 1H)

表 17-37

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
2-1	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79 (t, J = 7.3 Hz, 6H), 0.95– 1.20 (m, 4H), 1.40– 1.65 (m, 4H), 2.40– 2.60 (m, 1H), 3.02 (s, 3H), 3.81 (s, 2H), 3.93 (s, 2H), 4.57 (s, 2H), 6.78 (d, J = 8.8 Hz, 2H), 7.00– 7.40 (m, 9H), 7.55 (d, J = 8.8 Hz, 2H), 8.30 (s, 1H), 12.30 (br s, 1H).

表 17-38

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
3-1	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.81(t, J = 7.3 Hz, 6H), 1.05-1.13(m, 4H), 1.48-1.57(m, 4H), 2.5-2.56(m, 1H), 5.09(s, 2H), 5.66(s, 2H), 7.09(d, J = 9.04 Hz, 2H), 7.19(d, J = 8.32 Hz, 2H), 7.38(d, J = 8.12 Hz, 2H), 7.91(d, J = 9.04 Hz, 2H), 7.98-7.99(m, 1H), 8.03(s, 1H), 8.64(d, J = 3 Hz, 1H), 8.72(d, J = 1.4 Hz, 1H), 13.52(s, 1H)
3-2	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.81(t, J=7.3Hz, 6H), 1.05-1.13(m, 4H), 1.48-1.57(m, 4H), 2.50-2.56(m, 1H), 5.09(s, 2H), 5.57(s, 2H), 7.09(d, J=9.2Hz, 2H), 7.17-7.19(m, 4H), 7.38(d, J=12.0Hz, 2H), 7.89-7.91(m, 4H), 8.01(s, 1H)
3-3	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.81(t, J=7.3Hz, 6H), 1.05-1.13(m, 4H), 1.48-1.57(m, 4H), 2.50-2.56(m, 1H), 4.78(s, 2H), 5.08(s, 2H), 7.07(d, J=8.8Hz, 2H), 7.18(d, J=8.1Hz, 2H), 7.37(d, J=8.0Hz, 2H), 7.51(d, J=8.0Hz, 2H), 7.82-7.86(m, 5H)
3-4	DMSO-d ₆ , 300MHz	1.14-1.49(m, 5H), 1.64-1.84(m, 5H), 2.44-2.54(m, 1H), 4.77(s, 2H), 5.08(s, 2H), 7.06(d, J=9.0Hz, 2H), 7.24(d, J=8.3Hz, 2H), 7.37(d, J=8.3Hz, 2H), 7.50(d, J=8.7Hz, 2H), 7.82-7.86(m, 5H)
3-5	DMSO-d ₆ , 400MHz	1.16-1.45(m, 5H), 1.67-1.83(m, 5H), 2.45-2.56(m, 1H), 5.07(s, 2H), 5.37(s, 2H), 7.00(d, J=9.0Hz, 2H), 7.24(d, J=8.1Hz, 2H), 7.36(d, J=8.1Hz, 2H), 7.65(d, J=9.0Hz, 2H), 7.94-7.96(m, 3H), 8.13(d, J=8.8Hz, 2H)
3-6	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.80(t, J=7.3Hz, 6H), 1.02-1.16(m, 4H), 1.46-1.60(m, 4H), 2.27(s, 3H), 2.54-2.58(m, 1H), 2.86(s, 3H), 4.68(s, 2H), 5.19(s, 2H), 7.10(d, J=0.8Hz, 2H), 7.18(d, J=8.3Hz, 2H), 7.39(d, J=8.3Hz, 2H), 7.78(s, 1H), 7.95-7.98(m, 3H), 8.13(d, J=8.3Hz, 2H), 13.39(brs, 1H)
3-7	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.78(t, J=7.4Hz, 6H), 0.97-1.16(m, 4H), 1.40-1.60(m, 4H), 2.30(s, 3H), 2.51-2.56(m, 1H), 3.17(s, 3H), 5.00(s, 2H), 5.19(s, 2H), 6.85(d, J=9.0Hz, 2H), 7.10(s, 1H), 7.11(s, 1H), 7.16(d, J=7.9Hz, 2H), 7.37(d, J=8.3Hz, 2H), 7.77(d, J=8.7Hz, 2H), 7.86(s, 1H), 7.96(s, 1H), 12.16(brs, 1H)

表 17-39

実施例	溶媒, Hz	NMR (δ)
3-8	DMSO-d ₆ , 300MHz	2.28(s, 3H), 3.36(s, 2H), 3.84(s, 2H), 4.19(s, 2H), 5.36(s, 2H), 7.07-7.08(m, 2H), 7.27-7.42(m, 5H), 7.67-7.77(m, 4H), 7.94-7.98(m, 2H)
3-9	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.80(t, J=7.3Hz, 6H), 1.02-1.14(m, 4H), 1.43-1.60(m, 4H), 2.29(s, 3H), 2.51-2.57(m, 1H), 3.35(s, 2H), 3.86(s, 2H), 4.19(s, 2H), 5.19(s, 2H), 7.10-7.10(m, 2H), 7.18(d, J=8.1Hz, 2H), 7.25-7.30(m, 1H), 7.33-7.42(m, 6H), 7.91(s, 1H), 7.94(br, 1H)
3-10	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.81(t, J=7.3Hz, 6H), 1.05-1.13(m, 4H), 1.48-1.57(m, 4H), 2.50-2.56(m, 1H), 3.40(s, 2H), 3.86(s, 2H), 4.17(s, 2H), 5.07(s, 2H), 7.06(d, J=9.2Hz, 2H), 7.19(d, J=6.0Hz, 2H), 7.26-7.68(m, 5H), 7.86-7.90(m, 3H)
3-11	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.72(t, J=7.4Hz, 6H), 1.48-1.55(m, 2H), 1.61-1.68(m, 2H), 2.30-2.33(m, 1H), 3.35(s, 2H), 3.86(s, 2H), 4.17(s, 2H), 5.08(s, 2H), 7.06(d, J=8.4Hz, 2H), 7.19(d, J=7.2Hz, 2H), 7.26-7.38(m, 7H), 7.86-7.87(m, 3H)
3-12	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.86(d, J=6.6Hz, 6H), 1.29(s, 9H), 1.79-1.88(m, 1H), 2.45(d, J=7.4Hz, 2H), 3.37(s, 2H), 3.87(s, 2H), 4.20(s, 2H), 5.21(s, 2H), 7.11-7.19(m, 3H), 7.25-7.44(m, 8H), 7.93(s, 1H), 8.18(d, J=2.6Hz, 1H), 12.41(brs, 1H)
3-13	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.80(t, J=7.3Hz, 6H), 1.02-1.16(m, 4H), 1.41-1.62(m, 4H), 2.52-2.59(m, 1H), 3.36(s, 2H), 3.86(s, 2H), 4.19(s, 2H), 5.26(s, 2H), 7.18-7.42(m, 11H), 8.00(s, 1H), 8.11(d, J=2.9Hz, 1H), 12.41(brs, 1H)
3-14	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.72(t, J=7.4Hz, 6H), 1.48-1.55(m, 2H), 1.61-1.68(m, 2H), 2.30-2.33(m, 1H), 3.37(s, 2H), 3.85(s, 2H), 4.16(s, 2H), 5.08(s, 2H), 7.06(d, J=8.8Hz, 2H), 7.18-7.28(m, 4H), 7.36-7.42(m, 4H), 7.86-7.89(m, 3H)

表 17-40

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
3-15	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.72(t, J=7.4Hz, 6H), 1.19(d, J=6.9Hz, 6H), 1.45-1.53(m, 2H), 1.63-1.66(m, 2H), 2.33-2.36(m, 1H), 2.85-2.88(m, 1H), 3.35(s, 2H), 3.83(s, 2H), 4.16(s, 2H), 5.09(s, 2H), 7.07(d, J=11.2Hz, 2H), 7.17-7.23(m, 4H), 7.31(d, J=8.1Hz, 2H), 7.39(d, J=8.1Hz, 2H), 7.85-7.87(m, 3H)
3-16	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.72(t, J=7.4Hz, 6H), 1.45-1.53(m, 2H), 1.63-1.66(m, 2H), 2.30-2.34(m, 1H), 3.40(s, 2H), 3.97(s, 2H), 4.30(s, 2H), 5.09(s, 2H), 7.07(d, J=8.1Hz, 2H), 7.08(d, J=8.0Hz, 2H), 7.18(d, J=8.0Hz, 2H), 7.38(d, J=8.0Hz, 2H), 7.65(d, J=8.0Hz, 2H), 7.72(d, J=8.0Hz, 2H), 7.84-7.87(m, 3H)
3-17	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.72(t, J=7.4Hz, 6H), 1.45-1.53(m, 2H), 1.63-1.66(m, 2H), 2.30-2.34(m, 1H), 3.37(s, 2H), 3.85(s, 2H), 4.30(s, 2H), 5.09(s, 2H), 7.08(d, J=8.0Hz, 2H), 7.19(d, J=8.0Hz, 2H), 7.37-7.44(m, 6H), 7.86-7.90(m, 3H)
3-18	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.72(t, J=7.4Hz, 6H), 1.45-1.53(m, 2H), 1.63-1.66(m, 2H), 2.26(s, 6H), 2.30-2.40(m, 1H), 3.48(s, 2H), 3.89(s, 2H), 4.25(s, 2H), 5.09(s, 2H), 6.92(s, 1H), 7.03-7.08(m, 4H), 7.20(d, J=8.0Hz, 2H), 7.38(d, J=8.0Hz, 2H), 7.86-7.91(m, 3H)
3-19	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.81(t, J=7.3Hz, 6H), 1.05-1.13(m, 4H), 1.48-1.57(m, 4H), 2.50-2.56(m, 1H), 3.45(s, 2H), 4.00(s, 2H), 4.23(s, 2H), 5.07(s, 2H), 7.06(d, J=9.2Hz, 2H), 7.19(d, J=5.6Hz, 2H), 7.36-7.37(m, 1H), 7.35-7.37(m, 2H), 7.57-7.60(m, 1H), 7.81-7.85(m, 4H), 8.48-8.49(m, 1H)
3-20	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.72(t, J=7.4Hz, 6H), 1.48-1.55(m, 2H), 1.61-1.68(m, 2H), 2.30-2.33(m, 1H), 3.46(s, 2H), 4.02(s, 2H), 4.23(s, 2H), 5.09(s, 2H), 7.07(d, J=11.6Hz, 2H), 7.18(d, J=8.1Hz, 2H), 7.26-7.29(m, 1H), 7.39(d, J=9.0Hz, 2H), 7.57(d, J=9.0Hz, 1H), 7.80-7.87(m, 4H), 8.50(d, J=3.9Hz, 1H)

表 17-41

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
3-21	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.80(t, J=7.2Hz, 6H), 0.99-1.19(m, 4H), 1.42-1.62(m, 4H), 2.29(s, 3H), 2.46-2.58(m, 1H), 3.45(s, 2H), 4.01(s, 2H), 4.24(s, 2H), 5.19(s, 2H), 7.10(s, 2H), 7.18(d, J=8.1Hz, 2H), 7.25-7.30(m, 1H), 7.39(d, J=8.1Hz, 2H), 7.57(d, J=7.8Hz, 1H), 7.80(dt, J=1.9, 7.8Hz, 1H), 7.90(s, 1H), 7.93(s, 1H), 8.49-8.51(m, 1H)
3-22	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.81(t, J=7.3Hz, 6H), 1.05-1.13(m, 4H), 1.48-1.57(m, 4H), 2.50-2.56(m, 1H), 4.09(s, 2HX0.55), 4.21(s, 2HX0.45), 4.80(s, 2HX0.45), 4.97(s, 2HX0.55), 5.09(s, 2H), 7.08(d, J=9.2Hz, 2H), 7.20(d, J=8.0Hz, 2H), 7.36-7.38(m, 3H), 7.46-7.48(m, 4H), 7.87-7.89(m, 3H)
3-23	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.72(t, J=7.4Hz, 6H), 1.45-1.53(m, 2H), 1.63-1.66(m, 2H), 2.33-2.36(m, 4H), 4.10(s, 1H), 4.20(s, 1H), 4.82(s, 1H), 4.94(s, 1H), 5.10(s, 2H), 7.09(d, J=9.0Hz, 2H), 7.18(d, J=8.1Hz, 2H), 7.26-7.28(m, 3H), 7.37-7.40(m, 3H), 7.86-7.91(m, 3H)
3-24	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.81(t, J=7.3Hz, 6H), 1.05-1.13(m, 4H), 1.48-1.57(m, 4H), 2.50-2.56(m, 1H), 3.78(s, 3H), 4.11(s, 2H), 4.86-4.92(m, 2H), 5.08(s, 2H), 7.02(d, J=8.0Hz, 2H), 7.10(d, J=8.0Hz, 2H), 7.20(d, J=4.0Hz, 2H), 7.36-7.41(m, 4H), 7.86-7.96(m, 3H)
3-25	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79(t, J=7.4Hz, 6H), 0.96-1.17(m, 4H), 1.41-1.62(m, 4H), 2.29(s, 3H), 2.46-2.57(m, 1H), 3.05-3.22(m, 2H), 3.91(d, J=15.5Hz, 1H), 3.95-3.99(m, 1H), 4.09(d, J=15.5Hz, 1H), 4.26(d, J=15.5Hz, 1H), 4.40(d, J=15.5Hz, 1H), 5.20(s, 2H), 7.02-7.19(m, 8H), 7.39(d, J=8.3Hz, 2H), 7.92(s, 1H)

表 17-42

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
3-26	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.81(t, J=7.3Hz, 6H), 1.04-1.15(m, 4H), 1.46-1.59(m, 4H), 2.52-2.57(m, 1H), 3.10(dd, J=3.5, 16.2Hz, 1H), 3.17(dd, J=6.0, 16.4Hz, 1H), 3.92(d, J=15.8Hz, 1H), 3.94-3.97(m, 1H), 4.09(d, J=15.8Hz, 1H), 4.25(d, J=15.8Hz, 1H), 4.39(d, J=15.8Hz, 1H), 5.08(s, 2H), 7.02-7.16(m, 6H), 7.18(d, J=8.1Hz, 2H), 7.38(d, J=8.1Hz, 2H), 7.86(s, 1H), 7.87(d, J=8.8Hz, 2H)
3-27	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.84 (s, 9 H), 2.42 (s, 3 H), 3.03 (s, 3 H), 3.35 (s, 2 H), 3.85 (s, 2 H), 4.15 (s, 2 H), 4.58 (s, 2 H), 6.76 (d, J = 8.8 Hz, 2 H), 7.05 (d, J = 7.9 Hz, 2 H), 7.11 (d, J = 8.1 Hz, 2 H), 7.26 (t, J = 6.9 Hz, 1 H), 7.34 (t, J = 7.4 Hz, 2 H), 7.39 (d, J = 7.0 Hz, 2 H), 7.65 (s, 1 H), 7.70 (d, J = 8.8 Hz, 2 H), 12.37 (br s, 1 H).
3-28	DMSO-d ₆ , 300MHz	1.18-1.20(m,2H), 1.24(s,9H), 1.55-1.76(m,2H), 2.28-2.47(m,1H), 2.98(s,3H), 3.25(d,J = 6.0Hz, 2H), 3.36(s,2H), 3.87(s,2H), 4.16(s,2H), 6.72(d,J = 9.0Hz, 2H), 7.12(d,J = 9.0Hz, 2H), 7.23-7.28(m,3H), 7.31-7.44(m,4H), 7.65(s,1H), 7.73(d,J = 9.0Hz, 2H)
3-29	DMSO-d ₆ , 300MHz	1.20-1.45(m, 5H), 1.65-1.80(m, 5H), 1.40-1.45(m, 1H), 3.03(s, 3H), 3.35(s, 2H), 3.86(s, 2H), 4.15(s, 2H), 4.56(s, 2H), 6.76(d, J=12.0Hz, 2H), 7.09-7.16(m, 4H), 7.26-7.39(m, 5H), 7.66-7.72(m, 3H)
3-30	DMSO-d ₆ , 300MHz	1.20-1.40(m, 5H), 1.60-1.80(m, 5H), 2.45-2.50(m, 1H), 2.51(t, J=6.0Hz, 2H), 2.77(t, J=6.0Hz, 2H), 3.02(s, 3H), 3.69(s, 2H), 3.92(s, 2H), 4.56(s, 2H), 6.75(d, J=9.0Hz, 2H), 7.09-7.16(m, 4H), 7.31-7.41(m, 5H), 7.64(s, 1H), 7.71(d, J=9.0Hz, 2H)
3-31	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.84 (s, 9 H), 2.42 (s, 2 H), 2.87 (s, 3 H), 3.31 (s, 2 H), 3.35 (s, 2 H), 3.86 (s, 2 H), 4.15 (s, 2 H), 6.72 (d, J = 9.0 Hz, 2 H), 7.03 (d, J = 7.9 Hz, 2 H), 7.14 (d, J = 7.9 Hz, 2 H), 7.23- 7.29 (m, 1 H), 7.32- 7.44 (m, 4 H), 7.65 (s, 1 H), 7.72 (d, J = 9.0 Hz, 2 H), 12.40 (br s, 1 H).

表 17-43

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
3-32	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.89(d, J=6.5Hz, 3H), 1.01-1.05(m, 2H), 1.30-1.45(m, 3H), 1.70-1.75(m, 4H), 3.35(s, 2H), 3.86(s, 2H), 4.15(s, 2H), 4.55(s, 2H), 6.76(d, J=9.0Hz, 2H), 7.09-7.16(m, 4H), 7.26-7.29(m, 1H), 7.35-7.41(m, 4H), 7.65(s, 1H), 7.71(d, J=8.9Hz, 2H)
3-33	DMSO-d ₆ , 300MHz	1.55-1.64(m, 6H), 1.92-2.03(m, 2H), 2.50-2.55(m, 1H), 3.35(s, 2H), 3.86(s, 2H), 4.15(s, 2H), 4.57(s, 2H), 4.83(d, J = 15.0Hz, 1H), 6.77(d, J = 9.0Hz, 2H), 7.13-7.16(m, 4H), 7.32-7.39(m, 4H), 7.65(s, 1H), 7.71(d, J = 8.8Hz, 2H)
3-34	DMSO-d ₆ , 400MHz	1.12-1.21(m, 2H), 1.32-1.43(m, 2H), 1.78(d, J = 12.0Hz, 4H), 2.40-2.50(m, 2H), 2.96(s, 3H), 3.24(d, J = 4.0Hz, 2H), 3.35(s, 2H), 3.85(s, 2H), 4.14(s, 2H), 6.69(d, J = 8.0Hz, 2H), 7.63(s, 1H), 7.70(d, J = 8.0Hz, 2H)
3-35	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.92(s, 3H), 0.94(s, 3H), 1.23-1.63(m, 8H), 2.33-2.40(m, 1H), 3.02(s, 3H), 3.35(s, 2H), 3.85(s, 2H), 4.14(s, 2H), 4.55(s, 2H), 6.75(d, J=6.7Hz, 2H), 7.10(d, J=6.2Hz, 2H), 7.17(d, J=6.0Hz, 2H), 7.26(t, J=5.3Hz, 1H), 7.32-7.40(m, 4H), 7.64(s, 1H), 7.70(d, J=6.7Hz, 2H), 12.39(brs, 1H)
3-36	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.78 (t, J = 7.3 Hz, 6 H), 1.00- 1.18 (m, 4 H), 1.38- 1.59 (m, 4 H), 2.40- 2.58 (m, 1 H), 3.03 (s, 3 H), 3.32 (s, 2 H), 3.86 (s, 2 H), 4.15 (s, 2 H), 4.57 (s, 2 H), 6.77 (d, J = 8.9 Hz, 2 H), 7.06- 7.15 (m, 4 H), 7.21- 7.44 (m, 5 H), 7.66 (s, 1 H), 7.72 (d, J = 8.8 Hz, 2 H).
3-37	DMSO-d ₆ , 300MHz	3.08(s, 3H), 3.35(s, 2H), 3.86(s, 2H), 4.15(s, 2H), 4.66(s, 2H), 6.79(d, J=8.6Hz, 2H), 7.22-7.46(m, 10H), 7.60-7.65(m, 4H), 7.67(s, 1H), 7.73(d, J=9.0Hz, 2H)

表 17-44

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
3-38	DMSO-d ₆ , 300MHz	1.14-1.43(m, 5H), 1.63-1.82(m, 5H), 2.38-2.49(m, 1H), 2.94(s, 2H), 3.02(s, 3H), 3.90(s, 2H), 4.19(s, 2H), 4.55(s, 2H), 6.75(d, J=9.0Hz, 2H), 7.11(d, J=8.3Hz, 2H), 7.15(d, J=8.3Hz, 2H), 7.21(t, J=7.2Hz, 1H), 7.31(t, J=7.3Hz, 2H), 7.39(d, J=7.2Hz, 2H), 7.58(s, 1H), 7.70(d, J=9.0Hz, 2H)
3-39	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.85(d, J=6.8Hz, 6H), 1.75-1.81(m, 1H), 2.39(d, J=6.8Hz, 2H), 3.02(s, 3H), 3.34(s, 2H), 3.85(s, 2H), 4.14(s, 2H), 4.56(s, 2H), 6.76(d, J=8.0Hz, 2H), 7.08-7.10(m, 4H), 7.20-7.25(m, 1H), 7.33-7.40(m, 4H), 7.64(s, 1H), 7.69(d, J=8.0Hz, 2H)
3-40	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.78(t, J=7.3Hz, 6H), 0.99-1.15(m, 4H), 1.40-1.56(m, 4H), 2.43-2.52(m, 1H), 2.93(s, 2H), 3.02(s, 3H), 3.90(s, 2H), 4.19(s, 2H), 4.56(s, 2H), 6.75(d, J=9.1Hz, 2H), 7.08(d, J=8.3Hz, 2H), 7.11(d, J=8.3Hz, 2H), 7.20(t, J=7.3Hz, 1H), 7.30(t, J=7.3Hz, 2H), 7.38(d, J=7.3Hz, 2H), 7.58(s, 1H), 7.69(d, J=9.1Hz, 2H)
3-41	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.97 (s, 9H), 2.89 (s, 2H), 3.02 (s, 3H), 3.86 (s, 2H), 4.15 (s, 2H), 4.56 (s, 2H), 6.75 (d, J = 8.87 Hz, 2H), 7.13 (d, J = 8.25 Hz, 2H), 7.25-7.40 (m, 7H), 7.67 (s, 1H), 7.71 (d, J = 8.87, 2H)
3-42	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.86 (d, J = 6.72, 6H), 1.40-1.46 (m, 2H), 1.61-1.71 (m, 1H), 2.90 (d, J = 7.64 Hz, 1H), 2.92 (d, J = 7.64 Hz, 1H), 3.03 (s, 3H), 3.85 (s, 2H), 4.15 (s, 2H), 4.57 (s, 2H), 6.74 (d, J = 9.04 Hz, 2H), 7.14 (d, J = 8.36 Hz, 2H), 7.24-7.28 (m, 3H), 7.32-7.40 (m, 4H), 7.66 (s, 1H), 7.70 (d, J = 9.04, 2H)
3-43	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.81 (t, J = 7.2 Hz, 6 H), 1.44 (tq, J = 7.8, 7.2 Hz, 4 H), 3.19 (dd, J = 7.8, 7.8 Hz, 4 H), 3.34 (s, 3 H), 3.36 (s, 2 H), 3.86 (s, 2 H), 4.17 (s, 2 H), 6.40 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.12 (d, J = 9.0 Hz, 2 H), 7.17 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.21-7.43 (m, 5 H), 7.84 (d, J = 9.0 Hz, 2 H), 8.00 (s, 1 H), 12.38 (br s, 1 H).

表 17-45

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
3-44	DMSO-d ₆ , 300MHz	1.12-1.20(m,15H), 2.80-2.89(m,2H), 3.24(s,2H), 3.15-3.52(m,2H), 3.82(s,2H), 4.15(s,2H), 4.52(s,2H), 6.70(d,J = 9.0Hz, 2H), 7.13-7.22(m,8H), 7.31(d,J = 9.0Hz, 2H), 7.61(s,1H), 7.68(d,J = 9.0Hz, 2H)
3-45	DMSO-d ₆ , 300MHz	1.15-1.19(m,18H), 2.76-2.89(m,1H), 3.79(s,2H), 4.11(s,2H), 4.27-4.33(m,1H), 4.38(s,2H), 6.69(d,J = 9.0Hz, 2H), 7.15-7.32(m,8H), 7.60-7.66(m,3H)
3-46	DMSO-d ₆ , 300MHz	1.14(d,J = 6.0Hz, 6H), 1.17(s,9H), 1.24(d,J = 6.0Hz, 6H), 2.74-2.90(m,1H), 3.79(s,2H), 4.12(s,2H), 4.23-4.36(m,1H), 4.38(s,2H), 6.68(d,J = 6.0Hz, 2H), 7.14-7.17(m,3H), 7.27-7.42(m,4H), 7.60-7.72(m,3H)
3-47	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.82(d, J=19.6Hz, 6H), 1.75-1.82(m, 1H), 2.40(d, J=14.4Hz, 2H), 3.03(s, 3H), 3.34(s, 2H), 3.84(s, 2H), 4.26(s, 2H), 4.56(s, 2H), 6.77(d, J=8.0Hz, 2H), 7.08-7.11(m, 4H), 7.40-7.41(m, 4H), 7.64(s, 1H), 7.69(d, J=8.0Hz, 2H)
3-48	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79(t, J = 6.0Hz, 6H), 1.04-1.13(m,4H), 1.48-1.56(m,4H), 2.49-2.51(m,1H), 3.05(s,3H), 3.44(m,2H), 3.91(s,2H), 4.22(s,2H), 4.62(s,2H), 6.78(d,J = 9.0Hz, 1H), 7.15(d,J = 9.0Hz, 2H), 7.20-7.24(m,3H), 7.30-7.35(m,5H), 7.69-7.74(m,2H)
3-49	DMSO-d ₆ , 300MHz	3.05(s,3H), 3.36(s,2H), 3.85(s,2H), 4.14(s,2H), 4.61(s,2H), 6.74-6.79(m,2H), 7.20-7.42(m,9H), 7.66(s,1H), 7.72(d,J = 6.0Hz, 2H)
3-50	DMSO-d ₆ , 300MHz	3.04(s,3H), 3.42(s,2H), 4.02(s,2H), 4.22(s,2H), 4.61(s,2H), 6.76(d,J = 6.0Hz, 2H), 7.20-7.44(m,8H), 7.64-7.72(m,4H)
3-51	DMSO-d ₆ , 300MHz	3.05(s,3H), 3.40(s,2H), 3.87(s,2H), 4.13(s,2H), 4.62(s,2H), 6.77(d,J = 9.0Hz, 2H), 7.20-7.45(m,6H), 7.58-7.74(m,6H)

表 17-46

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
3-52	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.89(d, J=6.0Hz, 3H), 1.00-1.80(m, 2H), 1.33-1.46(m, 3H), 1.72-1.75(m, 4H), 2.35-2.43(m, 1H), 2.95(s, 2H), 3.02(s, 3H), 4.10(s, 2H), 4.22(s, 2H), 4.55(s, 2H), 6.74(d, J=9.1Hz, 2H), 7.09-7.11(m, 4H), 7.16-7.22(m, 1H), 7.57-7.79(m, 5H), 8.45(d, J=4.1Hz, 2H)
3-53	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79(t, J=7.3Hz, 6H), 0.97-1.16(m, 4H), 1.36-1.59(m, 4H), 2.43-2.53(m, 1H), 3.03(s, 3H), 3.44(s, 2H), 4.00(s, 2H), 4.21(s, 2H), 4.57(s, 2H), 6.77(d, J=9.1Hz, 2H), 7.09(d, J=8.7Hz, 2H), 7.12(d, J=8.7Hz, 2H), 7.28(dd, J=7.5, 4.5Hz, 1H), 7.57(d, J=7.5Hz, 1H), 7.65(s, 1H), 7.71(d, J=9.1Hz, 2H), 7.81(dt, J=1.9, 7.5Hz, 1H), 8.50(dd, J=4.5, 1.9Hz, 1H)
3-54	DMSO-d ₆ , 300MHz	3.04(s,3H), 3.39(s,2H), 4.21(s,2H), 4.36(s,2H), 4.61(s,2H), 6.76(d, J = 9.0Hz, 2H), 7.20-7.35(m,5H), 7.44-7.72(m,9H), 7.85-7.91(m,2H), 8.41-8.444(m,1H)
3-55	DMSO-d ₆ , 300MHz	3.05(s,3H), 3.51(s,2H), 4.22(s,2H), 4.27(s,2H), 4.61(s,2H), 6.76(d, J = 9.0Hz, 2H), 7.23(t, J = 9.0Hz, 3H), 7.32(t, J = 9.0Hz, 2H), 7.57-7.82(m,7H), 7.98(t, J = 6.0Hz, 2H), 8.42(d, J = 9.0Hz, 1H)
3-56	DMSO-d ₆ , 300MHz	3.06(s,3H), 3.96(s,1H), 4.13(d, J = 12.0Hz, 2H), 4.44(s,1H), 4.63(s,2H), 4.82(s,1H), 5.10(s,1H), 6.78(d, J = 9.0Hz, 2H), 7.21-7.37(m,7H), 7.52(d, J = 6.0Hz, 1H), 7.66-7.76(m,4H), 7.96-7.98(m,1H)
3-57	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.84(t, J=7.3Hz, 6H), 1.73-1.78(m, 1H), 2.40(d, J=7.2Hz, 2H), 3.03(s, 3H), 3.70(s, 1H), 3.90(s, 1H), 4.07(s, 1H), 4.34(s, 1H), 4.57(s, 2H), 4.78(s, 1H), 5.02(s, 1H), 6.75-6.77(m, 2H), 7.10-7.12(m, 4H), 7.24-7.27(m, 2H), 7.33-7.36(m, 2H), 7.64-7.71(m, 3H)
3-58	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.846(t, J=7.4H, 6H), 1.18(t, J=8.4Hz, 6H), 1.76-1.81(m, 1H), 2.40(d, J=6.8Hz, 2H), 2.82-2.86(m, 1H), 3.03(s, 3H), 3.63(s, 1H), 3.83(s, 1H), 4.06(s, 1H), 4.30(s, 1H), 4.55(s, 2H), 4.78(s, 1H), 4.99(s, 1H), 6.75-6.77(m, 2H), 7.07-7.16(m, 8H), 7.64-7.72(m, 3H)

表 17-47

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
3-59	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.82-0.90(m, 12H), 1.74-1.81(m, 1H), 2.02-2.04(m, 1H), 2.15(d, J=8.0Hz, 1H), 2.33(d, J=8.0Hz, 1H), 2.39(d, J=7.0Hz, 2H), 3.02(s, 3H), 4.03(s, 1H), 4.24(s, 1H), 4.56(s, 2H), 4.74(s, 1H), 4.91(s, 1H), 6.72-6.76(m, 2H), 7.05-7.11(m, 4H), 7.61-7.70(m, 3H)
3-60	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.85 (s, 9 H), 2.43 (s, 2 H), 3.04 (s, 3 H), 4.21 (s, 2 H), 4.59 (s, 2 H), 4.90 (s, 2 H), 6.77 (d, J = 8.9 Hz, 2 H), 6.96 (d, J = 7.3 Hz, 1 H), 7.07 (d, J = 8.2 Hz, 2 H), 7.13 (d, J = 8.1 Hz, 2 H), 7.24 (dd, J = 7.9, 7.9 Hz, 2 H), 7.45 (d, J = 7.6 Hz, 2 H), 7.67 (s, 1 H), 7.73 (d, J = 8.8 Hz, 2 H), 8.79 (s, 1 H), 12.58 (br s, 1 H).
3-61	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.83(d, J=12.0Hz, 6H), 1.75-1.82(m, 1H), 2.40(d, J=16.0Hz, 2H), 3.03(s, 3H), 4.07(s, 1H), 4.19(s, 1H), 4.57(s, 2H), 4.77(s, 1H), 4.93(s, 1H), 6.76(d, J=8.0Hz, 2H), 7.09-7.12(m, 4H), 7.36-7.37(m, 1H), 7.45-7.48(m, 4H), 7.67-7.71(m, 3H)
3-62	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.81(t, J=7.3Hz, 6H), 1.05-1.13(m, 4H), 1.43-1.57(m, 4H), 2.31(s, 3H), 2.50-2.56(m, 1H), 3.00(s, 3H), 3.92(s, 2HX0.58), 4.15(s, 2HX0.42), 4.57 (s, 2H), 4.78 (s, 2HX0.42), 4.90(s, 2HX0.58), 6.77(d, J=8.0Hz, 2H), 7.07-7.13(m, 4H), 7.23-7.39(m, 4H), 7.69-7.73(m, 3H)
3-63	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.81(t, J=7.3Hz, 6H), 1.05-1.13(m, 4H), 1.21(d, J=8.0Hz, 6H), 1.42-1.52(m, 4H), 2.48-2.50(m, 1H), 2.89-2.93(m, 1H), 3.20(s, 3H), 3.45(s, 2H), 4.57(s, 2H), 4.88(s, 2H), 6.77(d, J=8.0Hz, 2H), 7.08-7.13(m, 4H), 7.26(d, J=8.0Hz, 2H), 7.40(d, J=8.0Hz, 2H), 7.66(s, 1H), 7.73(d, J=8.0Hz, 2H)
3-64	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79(t, J = 9.0Hz, 6H), 1.02-1.12(m, 4H), 1.43-1.54(m, 4H), 2.96-2.06(m, 5H), 3.78(d, J = 15.0Hz, 1H), 4.16(d, J = 15.0Hz, 1H), 4.56(s, 2H), 4.72-4.76(m, 1H), 6.76(d, J = 9.0Hz, 2H), 7.05-7.12(m, 7H), 7.48(s, 1H), 7.68(d, J = 9.0Hz, 2H)

表 17-48

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
3-65	DMSO-d ₆ , 300MHz	1.15-1.86(m, 13H), 2.12-2.29(m, 3H), 2.39-2.48(m, 1H), 2.82-2.91(m, 2H), 3.03(s, 3H), 3.81(s, 2H), 4.56(s, 2H), 6.75(d, J=9.1Hz, 2H), 7.11(d, J=8.4Hz, 2H), 7.16(d, J=8.4Hz, 2H), 7.64(s, 1H), 7.71(d, J=8.8Hz, 2H), 12.11(brs, 1H)
3-66	DMSO-d ₆ , 300MHz	1.20-1.82(m, 14H), 2.00-2.12(m, 2H), 2.16-2.20(m, 1H), 2.45-2.50(m, 1H), 2.78-2.82(m, 1H), 2.90-2.95(m, 1H), 3.02(s, 3H), 3.78(s, 2H), 4.55(s, 2H), 6.75(d, J=9.0Hz, 2H), 7.09-7.16(m, 4H), 7.62(s, 1H), 7.70(d, J=12.0Hz, 2H)
3-67	DMSO-d ₆ , 300MHz	1.20-1.40(m, 5H), 1.60-1.80(m, 7H), 2.20-2.50(m, 5H), 2.80-2.90(m, 2H), 3.03(s, 3H), 3.81(s, 2H), 4.56(s, 2H), 6.75(d, J=9.0Hz, 2H), 7.09-7.14(m, 4H), 7.25-7.28(m, 1H), 7.35-7.42(m, 4H), 7.63(s, 1H), 7.70(d, J=8.9Hz, 2H)
3-68	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.84(d, J=6.6Hz, 6H), 1.02-1.50(m, 12H), 1.65-1.81(m, 5H), 1.95-2.04(m, 2H), 2.15-2.26(m, 2H), 2.39-2.49(m, 1H), 2.69-2.79(m, 2H), 3.03(s, 3H), 3.78(s, 2H), 4.56(s, 2H), 6.75(d, J=9.1Hz, 2H), 7.10-7.17(m, 4H), 7.63(s, 1H), 7.70(d, J=8.8Hz, 2H)
3-69	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.89(d, J=6.0Hz, 3H), 1.00-1.10(m, 2H), 1.30-1.40(m, 3H), 1.72-1.95(m, 6H), 2.30-2.50(m, 5H), 2.80-2.90(m, 2H), 3.03(s, 3H), 3.81(s, 2H), 4.56(s, 2H), 6.75(d, J=9.0Hz, 2H), 7.09-7.17(m, 4H), 7.25-7.30(m, 1H), 7.32- 7.37(m, 4H), 7.64(s, 1H), 7.70(d, J=11.7Hz, 2H)
3-70	DMSO-d ₆ , 300MHz	1.08-1.19(m, 2H), 1.30-1.44(m, 2H), 1.57-1.67(m, 2H), 2.35-2.44(m, 2H), 2.75(d, J = 8.0Hz, 2H), 2.96(s, 3H), 3.25- 3.30(m, 4H), 3.74(s, 2H), 6.69(d, J = 8.0Hz, 2H), 7.08(t, J = 4.0Hz, 1H), 7.18-7.23(m, 5H), 7.28(d, J = 8.0Hz, 2H), 7.37(d, J = 8.0Hz, 2H), 7.59(s, 1H), 7.70(d, J = 12.0Hz, 2H)

表 17-49

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
3-71	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.89(d, J=4.8Hz, 3H), 1.01-1.10(m, 2H), 1.30-1.50(m, 3H), 1.70-1.80(m, 4H), 3.10-3.20(m, 1H), 3.10-3.20(m, 2H), 3.88-4.11(m, 3H), , 4.30(dd, J=37.7, 11.6Hz, 2H), 4.56(s, 2H), 6.76(d, J=9.0Hz, 2H), 7.04-7.17(m, 8H), 7.64(s, 1H), 7.72(d, J=8.8Hz, 2H)
3-72	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.84(d, J=6.8Hz, 6H), 1.70-1.80(m, 1H), 2.39(d, J=4.4Hz, 2H), 3.03(s, 3H), 3.10-3.20(m, 2H), 3.89-4.06(m, 3H), 4.22(d, J=15.6Hz, 1H), 4.36(d, J=15.6Hz, 1H), 4.57(s, 2H), 6.75(d, J=10.8Hz, 2H), 7.03-7.15(m, 8H), 7.64(s, 1H), 7.71(d, J=10.0Hz, 2H)
3-73	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79(t, J=7.4Hz, 6H), 1.01-1.14(m, 4H), 1.39-1.56(m, 4H), 2.43-2.48(m, 1H), 3.03(s, 3H), 3.11-3.16(m, 2H), 4.00(ABq, J=15.6, 41.6Hz, 2H), 3.95-3.97(m, 1H), 4.30(ABq, J=15.8, 50.1Hz, 2H), 4.57(s, 2H), 6.77(d, J=9.1Hz, 2H), 7.02-7.16(m, 8H), 7.65(s, 1H), 7.73(d, J=8.6Hz, 2H), 12.54(brs, 1H)
3-74	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.85 (s, 9 H), 2.43 (s, 2 H), 3.04 (s, 3 H), 3.10- 3.20 (m, 2 H), 3.92 (d, J = 16.1 Hz, 1 H), 3.90- 4.00 (m, 1 H), 4.10 (d, J = 7.7 Hz, 1 H), 4.23 (d, J = 15.7 Hz, 1 H), 4.37 (d, J = 15.7 Hz, 1 H), 4.59 (s, 2 H), 6.77 (d, J = 8.9 Hz, 2 H), 7.00- 7.20 (m, 8 H), 7.66 (s, 1 H), 7.72 (d, J = 8.8 Hz, 2 H), 12.50 (br s, 1 H).
3-75	DMSO-d ₆ , 400MHz	1.21-1.34(m, 5H), 1.69-1.74(m, 5H), 2.44-2.54(m, 1H), 3.02(s, 3H), 3.70(s, 3H), 4.55(s, 2H), 4.77(s, 2H), 6.54(s, 1H), 6.71(d, J=8.0Hz, 2H), 6.87(s, 1H), 7.11-7.14(m, 5H), 7.64(d, J=8.0Hz, 2H)
3-76	DMSO-d ₆ , 300MHz	1.20-1.45(m, 5H), 1.60-1.85(m, 5H), 2.45-2.50(m, 1H), 2.80-3.00(m, 2H), 3.35-3.38(m, 1H), 3.83(d, J=15.0Hz, 1H), 4.09(d, J=15.0Hz, 1H), 4.55(s, 2H), 6.74(d, J=9.0Hz, 2H), 7.09-7.25(m, 9H), 7.53(s, 1H), 7.67(d, J=9.0Hz, 2H)

表 17-50

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
3-77	DMSO-d ₆ , 400MHz	1.21-1.40(m, 5H), 1.69-1.80(m, 5H), 2.44-2.50(m, 1H), 3.90-3.96(m, 2H), 4.34(s, 1H), 4.55(s, 2H), 6.75(d, J=8.8Hz, 2H), 7.12-7.14(m, 4H), 7.28-7.40(m, 5H), 7.60(s, 1H), 7.69(d, J=8.3Hz, 2H)
3-78	DMSO-d ₆ , 400MHz	1.14(d, J=12.0Hz, 3H), 1.20-1.40(m, 5H), 1.65-1.80(m, 5H), 2.44-2.50(m, 1H), 3.05-3.08(m, 1H), 3.85(d, J=16.0Hz, 1H), 4.09(d, J=16.0Hz, 1H), 4.75(s, 2H), 6.74(d, J=8.0Hz, 2H), 7.09-7.15(m, 4H), 7.57(s, 1H), 7.70(d, J=8.8Hz, 2H)
3-79	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.83(d, J=14.0Hz, 6H), 1.78-1.90(m, 1H), 2.39(d, J=5.6Hz, 2H), 2.82-3.02(m, 2H), 3.02(s, 3H), 3.44- 3.45(m, 1H), 3.87(d, J=16.0Hz, 1H), 4.11(d, J=16.0Hz, 1H), 4.56(s, 2H), 6.73(d, J=8.0Hz, 2H), 7.08-7.11(m, 4H), 7.27-7.30(m, 4H), 7.55(s, 1H), 7.67(d, J=10.8Hz, 2H)
3-80	DMSO-d ₆ , 300MHz	1.08-1.35(m, 5H), 1.60-1.77(m, 5H), 2.44-2.54(m, 1H), 2.40(s, 3H), 2.44-2.50(m, 1H), 3.03(s, 3H), 3.38(s, 3H), 4.04(s, 2H), 4.56(s, 2H), 6.76(d, J=12.0Hz, 2H), 7.09- 7.17(m, 5H), 7.66-7.72(m, 2H)
3-81	DMSO-d ₆ , 300MHz	1.14-1.45(m, 5H), 1.63-1.83(m, 5H), 2.29(s, 3H), 2.39- 2.49(m, 1H), 2.43(t, J=7.2Hz, 2H), 2.74(t, J=7.1Hz, 2H), 3.03(s, 3H), 3.87(s, 2H), 4.56(s, 2H), 6.76(d, J=8.8Hz, 2H), 7.10-7.17(m, 4H), 7.65(s, 1H), 7.71(d, J=8.8Hz, 2H)
3-82	DMSO-d ₆ , 400MHz	1.19-1.41(m, 5H), 1.67-1.77(m, 5H), 2.26(s, 3H), 2.44- 2.47(m, 1H), 3.03(s, 3H), 3.66(s, 2H), 3.88(s, 2H), 4.56(s, 2H), 6.76(d, J=9.2, 2H), 7.10-7.16(m, 4H), 7.37(d, J=8.1, 2H), 7.66(s, 1H), 7.71(d, J=8.6, 2H), 7.87(d, J=9, 2H)
3-83	DMSO-d ₆ , 300MHz	1.16-1.41(m, 5H), 1.67-1.81(m, 5H), 2.41-2.48(m, 1H), 3.03(s, 3H), 3.07(s, 3H), 4.56(s, 2H), 4.84(s, 2H), 6.68(d, J=6.9Hz, 2H), 6.76(d, J=6.5Hz, 2H), 7.10-7.17(m, 4H), 7.57(s, 1H), 7.68-7.73(m, 4H)

表 17-51

实施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
3-84	DMSO-d ₆ , 400MHz	1.13-1.41(m, 5H), 1.65-1.81(m, 5H), 2.40-2.48(m, 1H), 3.03(s, 3H), 3.20(s, 3H), 4.56(s, 2H), 5.14(s, 2H), 6.75(d, J=9.0Hz, 2H), 6.80(d, J=9.0Hz, 1H), 7.09-7.15(m, 4H), 7.59(s, 1H), 7.70(d, J=9.0Hz, 2H), 7.97(dd, J=2.3, 9.0Hz, 1H), 8.64(dd, J=0.8, 2.4Hz, 1H), 12.46(brs, 1H)
3-85	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.83(d, J=13.6Hz, 6H), 1.70-1.80(m, 1H), 2.32-2.37(m, 5H), 2.90-3.00(m, 2H), 3.02(s, 3H), 3.60-3.70(m, 1H), 3.98(d, J=16.0Hz, 1H), 4.14(d, J=16.0Hz, 1H), 4.56(s, 2H), 6.74(d, J=9.2Hz, 2H), 7.08-7.11(m, 4H), 7.18-7.20(m, 1H), 7.25-7.27(m, 4H), 7.56(s, 1H), 7.67(d, J=8.0Hz, 2H)
3-86	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79 (t, J = 7.2 Hz, 6H), 0.96-1.15(m, 4H), 1.40-1.57(m, 4H), 2.37 (s, 3H), 2.41-2.5(m, 1H), 2.93 (dd, J = 14.1, 7.7, 1H), 3.02 (s, 3H), 3.06 (dd, J = 14.1, 7.7 Hz, 1H), 3.69 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 4.00 (d, J = 15.8 Hz, 1H), 4.15 (d, J = 15.8 Hz, 1H), 4.56 (s, 2H), 6.76 (d, J = 8.9 Hz, 2H), 7.09 (d, J = 8.6 Hz, 2H), 7.12 (d, J = 8.6 Hz, 2H), 7.19-7.28 (m, 5H), 7.57 (s, 1H), 7.69 (d, J = 8.9 Hz, 2H)
3-87	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79 (t, J = 7.2 Hz, 6H), 0.96-1.15(m, 4H), 1.40-1.57(m, 4H), 2.34 (s, 3H), 2.42-2.5(m, 1H), 3.02 (s, 3H), 3.83 (d, J = 15.3 Hz, 1H), 3.98 (d, J = 15.3 Hz, 1H), 4.50 (s, 1H), 4.56 (s, 2H), 6.76 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.08 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.12 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.33-7.48 (m, 5H), 7.64 (s, 1H), 7.70 (d, J = 8.7 Hz, 2H)
3-88	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.84 (s, 9 H), 2.33 (s, 3 H), 2.42 (s, 2 H), 3.02 (s, 3 H), 3.82 (d, J = 15.2 Hz, 1 H), 3.96 (d, J = 15.6 Hz, 1 H), 4.48 (s, 1 H), .00 (s, 2 H), 6.74 (d, J = 8.8 Hz, 2 H), 7.05 (d, J = 7.6 Hz, 2 H), 7.10 (d, J = 7.6 Hz, 2 H), 7.32 (t, J = 7.2 Hz, 1 H), 7.39 (t, J = 7.4 Hz, 2 H), 7.45 (d, J = 8.9 Hz, 2 H), 7.63 (s, 1 H), 7.65 (d, J = 15.2 Hz, 2 H).

表 17-52

实施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
3-89	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.84 (s, 9 H), 2.36 (s, 3 H), 2.42 (s, 2 H), 2.93 (dd, J = 14.2, 8.1 Hz, 1 H), 3.02 (s, 3 H), 3.05 (dd, J = 14.1, 7.2 Hz, 1 H), 3.68 (t, J = 8.0 Hz, 1 H), 4.01 (d, J = 12.0 Hz, 1 H), 4.14 (d, J = 15.6 Hz, 1 H), 4.57 (s, 2 H), 6.74 (d, J = 9.0 Hz, 2 H), 7.05 (d, J = 8.1 Hz, 2 H), 7.10 (d, J = 8.1 Hz, 2 H), 7.19 (q, J = 4.4 Hz, 1 H), 7.26 (d, J = 4.6 Hz, 2 H), 7.56 (s, 1 H), 7.67 (d, J = 8.8 Hz, 2 H), 12.48 (br s, 1 H).
3-90	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.79(t, J=7.3Hz, 6H), 1.00-1.14(m, 4H), 1.41-1.57(m, 4H), 2.44-2.48(m, 1H), 3.03(s, 3H), 3.51(s, 4H), 4.16(s, 2H), 4.57(s, 2H), 6.76(d, J=9.0Hz, 2H), 7.09(d, J=8.6Hz, 2H), 7.12(d, J=8.4Hz, 2H), 7.64(s, 1H), 7.70(d, J=9.0Hz, 2H)
3-91	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.83(d, J=5.0Hz, 6H), 1.17-1.41(m, 7H), 1.54-1.62(m, 1H), 1.67-1.77(m, 5H), 2.41-2.49(m, 1H), 2.66-2.70(m, 2H), 3.02(s, 3H), 3.41(s, 2H), 4.10(s, 2H), 6.74(d, J=6.9Hz, 2H), 7.09-7.15(m, 4H), 7.61(s, 1H), 7.69(d, J=6.6Hz, 2H)
3-92	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.84(d, J=6.7Hz, 6H), 0.91(d, J=17.6Hz, 3H), 0.95-1.05(m, 2H), 1.30-1.42(m, 5H), 1.50-1.60(m, 1H), 1.72-1.76(m, 4H), 2.45-2.50(m, 1H), 2.60-2.70(m, 2H), 3.02(s, 3H), 3.41(s, 2H), 4.10(s, 2H), 4.56(s, 2H), 6.75(d, J=9.0Hz, 2H), 7.09-7.17(m, 4H), 7.62(s, 1H), 7.70(d, J=8.8Hz, 2H)
3-93	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.87-0.84(m, 12H), 1.33-1.37(m, 2H), 1.58-4.61(m, 1H), 1.75-1.78(m, 1H), 2.39(d, J=7.2Hz, 2H), 2.65-2.69(m, 2H), 3.02(s, 3H), 3.40(s, 2H), 4.09(s, 2H), 4.56(s, 2H), 6.74(d, J=9.2Hz, 2H), 7.06-7.11(m, 4H), 7.61(s, 1H), 7.68(d, J=11.6Hz, 2H)
3-94	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.81(t, J=7.3Hz, 6H), 1.05-1.13(m, 4H), 1.48-1.57(m, 4H), 2.50-2.56(m, 1H), 3.00(s, 3H), 4.56(s, 2H), 5.61(s, 2H), 6.78(d, J=8.8Hz, 2H), 7.10-7.13(m, 4H), 7.75(d, J=8.4Hz, 2H), 7.81(s, 1H), 7.97(s, 1H), 8.63(s, 1H), 8.71(s, 1H)

表 17-53

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
3-95	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.81(t, J=7.3Hz, 6H), 1.05-1.13(m, 4H), 1.48-1.57(m, 4H), 2.50-2.56(m, 1H), 3.04(s, 3H), 4.58(s, 2H), 5.54(s, 2H), 6.78(d, J=8.8Hz, 2H), 7.10-7.13(m, 4H), 7.19(d, J=8.0Hz, 2H), 7.74(d, J=8.0Hz, 2H), 7.80(s, 1H), 7.91(d, J=9.2Hz, 2H)
3-96	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.81(t, J=7.3Hz, 6H), 1.05-1.13(m, 4H), 1.48-1.57(m, 4H), 2.50-2.56(m, 1H), 3.03(s, 3H), 4.57(s, 2H), 4.74(s, 2H), 6.76(d, J=9.2Hz, 2H), 7.10-7.13(m, 4H), 7.52(d, J=8.0Hz, 2H), 7.63(s, 1H), 7.69(d, J=9.2Hz, 2H), 7.83(d, J=8.0Hz, 2H)
3-97	DMSO-d ₆ , 300MHz	1.20-1.40(m, 5H), 1.60-1.80(m, 5H), 1.45-1.50(m, 1H), 3.02(s, 3H), 4.39(d, J=6.3Hz, 2H), 4.55(s, 2H), 6.73(d, J=9.0Hz, 2H), 7.10-7.17(m, 4H), 7.61-7.64(m, 3H), 7.94(d, J=8.4Hz, 2H), 8.11(d, J=8.4Hz, 2H), 8.80(t, J=6.3Hz, 1H)
3-98	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.92 (s, 3H), 0.95 (s, 3H), 1.40-1.61 (m, 8H), 2.31-2.41 (m, 1H), 2.85 (s, 3H), 3.03 (s, 3H), 4.56 (s, 2H), 4.65 (s, 2H), 6.74 (d, J = 8.82 Hz, 2H), 7.12 (d, J = 8.10 Hz, 2H), 7.18 (d, J = 8.10 Hz, 2H), 7.61 (d, J = 8.82 Hz, 2H), 7.69 (s, 1H), 7.97 (d, J = 8.36 Hz, 2H), 8.13 (d, J = 8.36, 2H)
3-99	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.92 (s, 3H), 0.95 (s, 3H), 1.40-1.61 (m, 8H), 2.31-2.41 (m, 1H), 2.91 (s, 3H), 3.03 (s, 3H), 4.04 (s, 2H), 4.57 (s, 2H), 4.67 (s, 2H), 6.76 (d, J = 8.84 Hz, 2H), 7.12 (d, J = 8.12 Hz, 2H), 7.18 (d, J = 8.12 Hz, 2H), 7.70 (s, 1H), 7.72 (d, J = 8.84 Hz, 2H)
3-100	DMSO-d ₆ , 300MHz	1.20-1.40(m, 5H), 1.60-1.77(m, 5H), 2.40-2.50(m, 1H), 2.84(s, 3H), 3.03(s, 3H), 4.55(s, 2H), 4.65(s, 2H), 6.73(d, J=9.0Hz, 2H), 7.90-7.16(m, 4H), 7.61(d, J=8.4Hz, 2H), 7.70(s, 1H), 7.97(d, J=8.1Hz, 2H), 8.13(d, J=8.1Hz, 2H)

表 17-54

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
3-101	DMSO-d ₆ , 300MHz	1.20-1.40(m, 5H), 1.60-1.77(m, 5H), 2.40-2.50(m, 1H), 2.85(s, 3H), 3.03(s, 3H), 4.56(s, 2H), 4.65(s, 2H), 6.74(d, J=9.0Hz, 2H), 7.09-7.17(m, 4H), 7.62(d, J=8.7Hz, 2H), 7.69(s, 1H), 7.75(t, J=7.8Hz, 1H), 8.09(d, J=8.8Hz, 1H), 8.20(d, J=7.8Hz, 1H), 8.28(s, 1H)
3-102	DMSO-d ₆ , 300MHz	1.20-1.40(m, 5H), 1.60-1.80(m, 5H), 1.45-1.50(m, 1H), 2.90(s, 3H), 3.03(s, 3H), 3.97(s, 2H), 4.56(s, 2H), 4.66(s, 2H), 6.76(d, J=8.7Hz, 2H), 7.09-7.16(m, 4H), 7.66-7.74(m, 3H)
3-103	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.92(s, 3H), 0.95(s, 3H), 1.24-1.60(m, 8H), 1.86-1.97(m, 2H), 2.34-2.42(m, 3H), 2.89(s, 3H), 3.04(s, 3H), 3.23-3.28(m, 2H), 4.57(s, 2H), 4.67(s, 2H), 6.77(d, J=8.8Hz, 2H), 7.12(d, J=8.4Hz, 2H), 7.19(d, J=8.1Hz, 2H), 7.70-7.74(m, 3H), 12.10(brs, 1H)
3-104	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.81(d, J=8.5Hz, 6H), 0.83-0.95(m, 1H), 1.20-1.45(m, 5H), 1.60-1.80(m, 5H), 2.40-2.50(m, 1H), 3.00-3.07(m, 5H), 4.22(s, 2H), 4.56(s, 2H), 4.73(s, 2H), 6.76(d, J=9.0Hz, 2H), 7.09-7.17(m, 4H), 7.70-7.73(m, 3H)
3-105	DMSO-d ₆ , 300MHz	1.14-1.46(m, 5H), 1.64-1.85(m, 5H), 2.38-2.49(m, 1H), 3.03(s, 3H), 4.56(s, 2H), 4.61(d, J=6.0Hz, 2H), 6.76(d, J=9.1Hz, 2H), 7.10-7.17(m, 4H), 7.64(s, 1H), 7.71(d, J=9.1Hz, 2H), 9.61(t, J=6.2Hz, 1H)
3-106	DMSO-d ₆ , 300MHz	1.19-1.43(m, 5H), 1.63-1.81(m, 5H), 2.40-2.47(m, 1H), 3.03(s, 3H), 3.23(s, 2H), 4.58(d, J=6.2Hz, 2H), 6.76(d, J=8.8Hz, 2H), 7.10-7.18(m, 4H), 7.63(s, 1H), 7.72(d, J=8.8Hz, 2H), 8.92(t, J=5.8Hz, 1H), 12.37(brs, 1H)
3-107	DMSO-d ₆ , 300MHz- 120°C	1.17-1.45(m, 5H), 1.66-1.85(m, 5H), 2.44-2.52(m, 1H), 3.01(s, 3H), 3.03(s, 3H), 4.52(s, 2H), 4.87(s, 2H), 6.80(d, J=8.8Hz, 2H), 7.14(s, 4H), 7.54(d, J=8.4Hz, 2H), 7.57(s, 1H), 7.71(d, J=8.8Hz, 2H), 7.99(d, J=8.4Hz, 2H)

表 17-55

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
3-108	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.89(d, J=6.6Hz, 3H), 1.00-1.50(m, 2H), 1.35-1.42(m, 3H), 1.72-1.76(m, 4H), 2.40-2.50(m, 1H), 3.04(s, 3H), 3.92(d, J=11.2Hz, 2H), 4.50-4.56(m, 4H), 5.40(d, J=6.0Hz, 2H), 6.77(d, J=9.0Hz, 2H), 7.09-7.17(m, 4H), 7.30-7.40(m, 5H), 7.70-7.76(m, 3H)
3-109	DMSO-d ₆ , 400MHz	1.21-1.41(m, 5H), 1.65-1.80(m, 5H), 1.45-1.50(m, 1H), 2.93(s, 3H), 3.03(s, 3H), 3.69-3.80(m, 2H), 4.56(s, 2H), 4.71(s, 2H), 6.75(d, J=11.6Hz, 2H), 6.94-7.05(m, 1H), 7.12-7.16(m, 4H), 7.64(s, 1H), 7.71(d, J=8.0Hz, 2H)
3-110	DMSO-d ₆ , 300MHz	1.15-1.25(m, 4H), 1.62-1.76(m, 6H), 3.68(s, 4H), 4.39(s, 2H), 5.21(s, 2H), 7.09(dd, J = 1.5, 9.0Hz, 1H), 7.48-7.52(m, 5H), 7.66-7.69(m, 6H), 7.77(s, 1H)
3-111	DMSO-d ₆ , 300MHz	1.20-1.40(m, 5H), 1.60-1.80(m, 5H), 2.60-2.75(m, 4H), 2.80-2.95(m, 4H), 3.42(s, 2H), 3.91(s, 2H), 4.56(s, 2H), 6.76(d, J=9.0Hz, 2H), 7.09-7.16(m, 4H), 7.69(d, J=4.9Hz, 2H), 7.73(s, 1H)
3-112	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.81(t, J=7.3Hz, 6H), 0.99-1.21(m, 4H), 1.41-1.65(m, 4H), 2.48-2.61(m, 1H), 2.96(dd, J=6.4, 16.2Hz, 1H), 3.19(dd, J=3.8, 16.2Hz, 1H), 3.68(d, J=15.1Hz, 1H), 4.24-4.44(m, 3H), 5.08(s, 2H), 6.95(d, J=6.0Hz, 1H), 6.98-7.11(m, 6H), 7.19(d, J=8.3Hz, 2H), 7.36(d, J=7.9Hz, 2H), 7.80(s, 1H), 7.87(d, J=8.7Hz, 2H)
3-113	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.80(t, J=7.2Hz, 6H), 1.07-1.14(m, 4H), 1.48-1.58(m, 4H), 2.5-2.6(m, 1H), 5.09(s, 2H), 5.55(s, 2H), 7.09(d, J=9.0Hz, 2H), 7.19(d, J=7.8Hz, 2H), 7.39(d, J=8.1Hz, 2H), 7.77-7.79(m, 1H), 7.91(d, J=8.7Hz, 2H), 8.00(s, 1H), 8.29(d, J=3.0Hz, 1H), 8.60(d, J=1.5Hz, 1H)
3-114	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.80(t, J=7.2Hz, 6H), 1.04-1.14(m, 4H), 1.48-1.58(m, 4H), 2.37(s, 3H), 2.49-2.53(m, 1H), 5.07(s, 2H), 5.65(s, 2H), 6.91(dd, J=8.6, 2.8Hz, 1H), 6.95(d, J=2.5Hz, 1H), 7.18(d, J=8.1Hz, 2H), 7.36(d, J=8.1Hz, 2H), 7.54(d, J=8.6Hz, 1H), 7.73(s, 1H), 7.95-7.96(m, 1H), 8.63(d, J=3.0Hz, 1H), 8.71(d, J=1.6Hz, 1H)

表 17-56

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
3-115	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.80(t, J=7.2Hz, 6H), 1.07-1.14(m, 4H), 1.48-1.58(m, 4H), 2.5-2.6(m, 1H), 3.83(s, 3H), 5.05(s, 2H), 5.66(s, 2H), 7.12(d, J=8.4Hz, 1H), 7.20(d, J=8.0Hz, 2H), 7.37(d, J=8.0Hz, 2H), 7.50-7.54(m, 2H), 7.99(s, 1H), 8.08(s, 1H), 8.63(s, 1H), 8.71(s, 1H)
3-116	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.80(t, J=7.2Hz, 6H), 1.05-1.14(m, 4H), 1.48-1.58(m, 4H), 2.37(s, 3H), 3.58(s, 2H), 3.63(s, 2H), 4.26(s, 2H), 5.07(s, 2H), 6.88(dd, J=8.0, 4.0Hz, 1H), 6.94(d, J=4.0Hz, 1H), 7.04(t, J=6.0Hz, 1H), 7.18(d, J=8.0Hz, 2H), 7.26(d, J=8.0Hz, 1H), 7.28(d, J=8.0Hz, 1H), 7.36(d, J=8.0Hz, 2H), 7.50(d, J=8.0Hz, 1H), 7.56-7.58(m, 3H)
3-117	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.80(t, J=7.2Hz, 6H), 1.05-1.14(m, 4H), 1.16(d, t=7.0Hz, 6H), 1.48-1.58(m, 4H), 2.37(s, 3H), 2.50-2.55(m, 1H), 2.8-2.90(m, 1H), 3.53(s, 4H), 4.23(s, 2H), 5.06(s, 2H), 6.88(dd, J=8.0, 4.0Hz, 1H), 6.94(d, J=4.0Hz, 1H), 7.05-7.19(m, 4H), 7.36(d, J=8.0Hz, 2H), 7.50-7.60(m, 4H)
3-118	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.81(t, J=7.4Hz, 6H), 0.99-1.20(m, 4H), 1.41-1.64(m, 4H), 2.48-2.61(m, 1H), 3.10(dd, J=2.6, 16.2Hz, 1H), 3.18(dd, J=5.7, 16.9Hz, 1H), 3.87-4.01(m, 2H), 4.09(d, J=15.8Hz, 1H), 4.25(d, J=15.8Hz, 1H), 4.40(d, J=15.5Hz, 1H), 5.09(s, 2H), 7.00-7.23(m, 8H), 7.38(d, J=8.3Hz, 2H), 7.84-7.93(m, 3H), 12.65(brs, 1H)
3-119	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.80(t, J=7.2Hz, 6H), 1.05-1.14(m, 4H), 1.48-1.58(m, 4H), 2.50-2.54(m, 1H), 3.58(s, 2H), 3.64(s, 2H), 3.80(s, 3H), 4.27(s, 2H), 5.40(s, 2H), 7.04(t, J=8.0Hz, 1H), 7.08(d, J=8.0Hz, 1H), 7.18(d, J=8.0Hz, 2H), 7.28(d, J=8.0Hz, 1H), 7.30(d, J=8.0Hz, 1H), 7.36(d, J=8.0Hz, 2H), 7.46(dd, J=8.0, 4.0Hz, 1H), 7.50(d, J=4.0Hz, 1H), 7.59(d, J=8.0Hz, 2H), 7.93(s, 1H)

表 17-57

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
3-120	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.80(t, J=7.2Hz, 6H), 1.05-1.14(m, 4H), 1.16(d, t=7.0Hz, 6H), 1.48-1.58(m, 4H), 2.50-2.55(m, 1H), 2.80-2.90(m, 1H), 3.56(s, 2H), 3.63(s, 2H), 3.80(s, 3H), 4.26(s, 2H), 5.03(s, 2H), 7.08(d, J=8.0Hz, 1H), 7.15-7.19(m, 4H), 7.36(d, J=8.0Hz, 2H), 7.44-7.50(m, 4H), 7.93(s, 1H)
3-121	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.80(t, J=7.2Hz, 6H), 1.05-1.14(m, 4H), 1.48-1.58(m, 4H), 2.38(s, 3H), 2.50-2.54(m, 1H), 3.45(s, 2H), 4.05(s, 2H), 4.19(s, 2H), 5.02(s, 2H), 6.89(d, J=8.0Hz, 1H), 6.94(d, J=4.0Hz, 1H), 7.18(d, J=8.0Hz, 2H), 7.36(d, J=8.0Hz, 2H), 7.51-7.56(m, 3H), 9.07(d, J=4.0Hz, 2H)
3-122	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.81(t, J=7.3Hz, 6H), 1.02-1.05(m, 4H), 1.40-1.50(m, 4H), 2.40(s, 3H), 2.49-2.53(m, 1H), 2.66(s, 3H), 3.85(s, 2H), 4.29(s, 2H), 4.51(s, 2H), 5.07(s, 2H), 6.91(dd, J=8.0, 4.0Hz, 1H), 6.96(d, J=4.0Hz, 1H), 7.18(d, J=8.0Hz, 2H), 7.36(d, J=8.0Hz, 2H), 7.53(d, J=8.0Hz, 1H), 7.55(s, 1H), 7.70(s, 1H)
3-123	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.81(t, J=7.3Hz, 6H), 1.05-1.15(m, 4H), 1.40-1.50(m, 4H), 2.38(s, 3H), 2.45-2.55(m, 1H), 3.58(s, 2H), 3.68(s, 2H), 4.30(s, 2H), 4.31(s, 2H), 5.07(s, 2H), 6.88(dd, J=12.0, 4.0Hz, 1H), 6.94(d, J=2.0Hz, 1H), 7.18(d, J=8.0Hz, 2H), 7.22-7.30(m, 5H), 7.36(d, J=8.0Hz, 2H), 7.51(d, J=8.0Hz, 1H), 7.62(s, 1H)
3-124	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.80(t, J=7.2Hz, 6H), 1.05-1.14(m, 4H), 1.48-1.58(m, 4H), 2.38(s, 3H), 2.50-2.54(m, 1H), 3.54(s, 2H), 4.17(s, 2H), 4.28(s, 2H), 5.06(s, 2H), 6.89(d, J=8.0Hz, 1H), 6.94(d, J=4.0Hz, 1H), 7.14-7.18(m, 4H), 7.35(d, J=8Hz, 2H), 7.49-7.56(m, 4H)
3-125	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79(t, J=7.2Hz, 6H), 1.00-1.14(m, 4H), 1.26(s, 9H), 1.40-1.58(m, 4H), 1.89-1.98(m, 2H), 2.42-2.55(m, 1H), 2.75-2.82(m, 2H), 3.35-3.42(m, 2H), 3.49(s, 2H), 4.19(s, 2H), 4.21(s, 2H), 4.49(s, 2H), 6.53(d, J=9.0Hz, 1H), 7.09-7.18(m, 5H), 7.45(d, J=9.0Hz, 1H), 7.49(s, 1H), 7.61(s, 1H), 12.58(brs, 1H)

表 17-58

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
3-126	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.81(t, J=7.2Hz, 6H), 1.00-1.19(m, 4H), 1.43-1.63(m, 4H), 1.98(brm, 4H), 2.53-2.59(m, 1H), 3.13(brs, 2H), 3.61(brs, 2H), 4.73(brs, 2H), 5.10(s, 2H), 7.12(d, J=9.1Hz, 2H), 7.20(d, J=7.9Hz, 2H), 7.38(d, J=8.3Hz, 2H), 7.93(d, J=8.7Hz, 2H), 8.14(brs, 1H), 10.74(brs, 1H), 12.52(brs, 1H)
3-127	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.81(t, J=7.3Hz, 6H), 1.02-1.19(m, 4H), 1.46-1.61(m, 4H), 2.52-2.59(m, 1H), 2.69(brs, 4H), 3.35(brs, 4H), 3.94(s, 2H), 5.09(s, 2H), 6.98(d, J=9.1Hz, 2H), 7.08(d, J=9.0Hz, 2H), 7.19(d, J=8.3Hz, 2H), 7.38(d, J=7.9Hz, 2H), 7.77(d, J=9.0Hz, 2H), 7.89(d, J=9.0Hz, 2H), 7.90(s, 1H), 12.27(brs, 1H)
3-128	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.71(t, J = 9.0Hz, 6H), 1.11(d, J = 6.0Hz, 6H), 1.29(t, J = 6.0Hz, 3H), 1.56-1.71(m, 4H), 2.38-2.42(m, 1H), 2.76-2.83(m, 1H), 4.26(q, J = 6.0, 2H), 5.66(s, 2H), 5.97(s, 2H), 7.05-7.20(m, 5H), 7.43(s, 1H), 7.49(d, J = 9.0Hz, 1H), 7.87(d, J = 9.0Hz, 2H), 8.47(s, 1H)
3-129	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.72(t, J = 6.0Hz, 6H), 1.11(d, J = 0.9Hz, 6H), 1.52-1.74(m, 4H), 2.42-2.46(m, 1H), 2.75-2.84(m, 1H), 5.66(s, 2H), 5.99(s, 2H), 7.06-7.18(m, 9H), 7.44(s, 1H), 7.50(d, J = 9.0Hz, 1H), 7.87(d, J = 9.0Hz, 2H), 8.48(s, 1H)
3-130	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79(t, J = 6.0Hz, 6H), 1.15(s, 3H), 1.57-1.89(m, 4H), 2.42-2.52(m, 1H), 5.43(s, 2H), 6.10(s, 2H), 6.99-7.09(m, 3H), 7.24-7.33(m, 15H), 7.65(t, J = 9.0Hz, 1H), 7.90(d, J = 6.3Hz, 1H), 7.99-8.03(m, 3H)
3-131	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.68(t, J = 6.0Hz, 6H), 1.48-1.76(m, 4H), 2.35-2.42(m, 1H), 5.61(s, 2H), 6.14(s, 2H), 7.07(s, 1H), 7.10(d, J = 9.0Hz, 2H), 7.20(d, J = 6.0Hz, 2H), 7.35(s, 1H), 7.62(d, J = 6.0Hz, 1H), 7.82(d, J = 6.0Hz, 2H), 7.83(d, J = 9.0Hz, 2H), 8.47(s, 1H)

表 17-59

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
3-132	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.74(t, J = 6.0Hz, 6H), 0.89-1.10(m, 9H), 1.42-1.778(m, 13H), 2.38-2.45(m, 1H), 4.58(d, J = 6.0Hz, 2H), 5.65(s, 2H), 7.08-7.16(m, 3H), 7.41(s, 1H), 7.53(d, J = 9.0Hz, 1H), 7.91(d, J = 9.0Hz, 2H), 8.42(s, 1H)

表 17-60

实施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
4-1	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79 (t, J = 7.3 Hz, 6H), 0.96- 1.18 (m, 4H), 1.34- 1.60 (m, 4H), 3.36 (s, 2H), 3.88 (s, 3H), 4.04 (s, 2H), 4.16 (s, 2H), 5.06 (s, 2H), 6.92 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.01 (d, J = 3.4 Hz, 1H), 7.07 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.14- 7.26 (m, 2H), 7.35 (d, J = 3.4 Hz, 1H), 7.46 (d, J = 8.3 Hz, 2H), 7.53 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.58- 7.65 (m, 3H), 12.52 (br s, 1H)
4-2	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.80(t, J=7.3Hz, 6H), 1.00-1.12(m, 4H), 1.38-1.57(m, 4H), 2.40-2.50(m, 1H), 5.07(s, 2H), 5.48(s, 2H), 6.93(d, J=8.6Hz, 2H), 7.07(d, J=8.6Hz, 2H), 7.49(d, J=7.9Hz, 2H), 7.69-7.71(m, 1H), 7.72(d, J=8.3Hz, 2H), 7.88-7.89(m, 1H), 7.91(d, J=1.5Hz, 1H), 8.56(d, J=2.6Hz, 1H), 8.69(d, J=1.5Hz, 1H), 13.41(brs, 1H)
4-3	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.78 (t, J = 7.4 Hz, 6 H), 1.00- 1.12 (m, 4 H), 1.15 (d, J = 6.4 Hz, 6 H), 1.30- 1.53 (m, 4 H), 2.27- 2.41 (m, 1 H), 4.22 (sept, J = 6.8 Hz, 1 H), 4.35 (s, 2 H), 5.48 (s, 2 H), 6.60 (d, J = 8.6 Hz, 2 H), 6.88 (d, J = 9.0 Hz, 2 H), 7.32 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 7.62 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.65 (d, J = 1.5 Hz, 1 H), 7.83 (d, J = 1.5 Hz, 1 H), 7.89 (dd, J = 3.0, 1.5 Hz, 1 H), 8.59 (d, J = 2.6 Hz, 1 H), 8.69 (d, J = 1.5 Hz, 1 H), 13.48 (br s, 1 H).
4-4	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.69 (t, J = 7.4 Hz, 6 H), 1.16 (d, J = 6.4 Hz, 6 H), 1.32- 1.47 (m, 2 H), 1.48- 1.64 (m, 2 H), 2.06- 2.18 (m, 1 H), 4.23 (sept, J = 6.6 Hz, 1 H), 4.36 (s, 2 H), 5.48 (s, 2 H), 6.62 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 6.88 (d, J = 9.0 Hz, 2 H), 7.32 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 7.62 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 7.65 (d, J = 1.1 Hz, 1 H), 7.83 (d, J = 1.5 Hz, 1 H), 7.89 (dd, J = 2.8, 1.7 Hz, 1 H), 8.59 (d, J = 3.0 Hz, 1 H), 8.69 (d, J = 1.5 Hz, 1 H), 13.48 (br s, 1 H).

表 17-61

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
4-5	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79(t, J=7.2Hz, 6H), 1.01-1.14(m, 4H), 1.37-1.58(m, 4H), 2.41-2.48(m, 1H), 5.07(s, 2H), 5.48(s, 2H), 6.93(d, J=8.7Hz, 2H), 7.07(d, J=8.7Hz, 2H), 7.26(d, J=3.8Hz, 1H), 7.45(d, J=3.8Hz, 1H), 7.49(d, J=8.3Hz, 2H), 7.67(d, J=8.3Hz, 2H), 7.88-7.90(m, 1H), 8.58(d, J=2.6Hz, 1H), 8.70(d, J=1.5Hz, 1H), 13.53(brs, 1H)
4-6	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79(t, J=7.3Hz, 6H), 0.97-1.17(m, 4H), 1.35-1.60(m, 4H), 2.38-2.53(m, 1H), 3.45(s, 2H), 4.12(s, 4H), 5.06(s, 2H), 6.93(d, J=8.7Hz, 2H), 7.07(d, J=8.7Hz, 2H), 7.11-7.20(m, 2H), 7.41-7.59(m, 5H), 7.69(d, J=8.3Hz, 2H), 7.75-7.80(m, 1H)
4-7	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.80 (t, J = 7.3 Hz, 6 H), 0.99- 1.17 (m, 4 H), 1.36- 1.59 (m, 4 H), 2.38- 2.53 (m, 1 H), 5.07 (s, 2 H), 5.63 (s, 2 H), 6.93 (d, J = 8.6 Hz, 2 H), 7.07 (d, J = 8.6 Hz, 2 H), 7.10 (dd, J = 8.3, 0.7 Hz, 1 H), 7.48 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 7.71 (d, J = 7.6 Hz, 2 H), 7.72 (d, J = 0.8 Hz, 1 H), 7.79 (d, J = 1.5 Hz, 1 H), 7.87 (d, J = 1.5 Hz, 1 H), 7.90 (dd, J = 8.3, 7.2 Hz, 1 H), 13.17 (br s, 1 H).
4-8	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.80(t, J=7.2Hz, 6H), 1.05-1.14(m, 4H), 1.48-1.58(m, 4H), 2.45-2.50(m, 1H), 3.42(s, 2H), 4.07(s, 4H), 5.06(s, 2H), 6.89(d, J=8.0Hz, 2H), 7.00-7.05(m, 3H), 7.11-7.13(m, 2H), 7.35(d, J=4.0Hz, 1H), 7.44(d, J=12.0Hz, 2H), 7.48-7.50(m, 2H), 7.60(d, J=8.0Hz, 2H)
4-9	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.77(t, J=7.3Hz, 6H), 1.02-1.05(m, 4H), 1.15(d, J=4.0Hz, 6H), 1.40-1.51(m, 4H), 2.40-2.45(m, 1H), 2.79-2.84(m, 1H), 3.44(s, 2H), 3.51(s, 2H), 4.04(s, 2H), 5.03(s, 2H), 6.89(d, J=8.0Hz, 2H), 6.99(d, J=4.0Hz, 1H), 7.03(d, J=8.0Hz, 2H), 7.14(d, J=8.0Hz, 2H), 7.33(d, J=4.0Hz, 1H), 7.43(d, J=8.0Hz, 2H), 7.48(d, J=8.0Hz, 2H), 7.58(d, J=8.0Hz, 2H)

表 17-62

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
4-10	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.77(t, J=7.3Hz, 6H), 1.02-1.05(m, 4H), 1.40-1.51(m, 4H), 2.40-2.45(m, 1H), 3.47(s, 2H), 3.51(s, 2H), 4.70(s, 2H), 5.05(s, 2H), 6.91(d, J=8.0Hz, 2H), 7.01(d, J=2.0Hz, 1H), 7.03-7.07(m, 3H), 7.28-7.31(m, 2H), 7.35(d, J=3.0Hz, 1H), 7.45(d, J=8.0Hz, 2H), 7.59-7.62(m, 4H)
4-11	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.68(t, J = 7.3 Hz, 6H), 1.15(d, J = 6.5 Hz, 6H), 1.34-1.45(m, 2H), 1.50-1.60(m, 2H), 2.08-2.15(m, 1H), 3.46(s, 2H), 3.50(s, 2H), 4.07(s, 2H), 4.21(sep, J = 6.5Hz, 1H), 4.34(s, 2H), 6.60(d, J = 8.8 Hz, 2H), 6.87(d, J = 8.8 Hz, 2H), 7.03(t, J = 7.3 Hz, 1H), 7.26-7.31(m, 4H), 7.40(s, 1H), 7.56-7.61(m, 4H), 7.69(s, 1H), 10.11(brs, 1H), 12.64(brs, 1H)
4-12	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.68(t, J = 7.3 Hz, 6H), 1.15(d, J = 6.5 Hz, 6H), 1.34-1.45(m, 2H), 1.50-1.60(m, 2H), 2.08-2.15(m, 1H), 3.41(s, 2H), 4.07(s, 2H), 4.11(s, 2H), 4.21(sep, J = 6.5Hz, 1H), 4.34(s, 2H), 6.60(d, J = 8.8 Hz, 2H), 6.88(d, J = 8.8 Hz, 2H), 7.15(s, 1H), 7.16(d, J = 8.6 Hz, 2H), 7.28(d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.38(s, 1H), 7.58(d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.70(s, 1H), 12.48(brs, 1H)
4-13	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.79(t, J=7.2Hz, 6H), 1.01-1.14(m, 4H), 1.33(s, 9H), 1.37-1.58(m, 4H), 2.41-2.51(m, 1H), 3.37(s, 2H), 4.09(s, 4H), 5.05(s, 2H), 6.91(d, J=8.4Hz, 2H), 7.05(d, J=8.4Hz, 2H), 7.39(s, 1H), 7.42(brs, 1H), 7.45(d, J=8.4Hz, 2H), 7.68(d, J=8.0Hz, 2H), 7.77(d, J=1.2Hz, 1H)
4-14	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.68 (t, J = 7.3 Hz, 6 H), 1.15 (d, J = 6.7 Hz, 6 H), 1.32-1.46 (m, 2 H), 1.48- 1.64 (m, 2 H), 2.05- 2.18 (m, 1 H), 3.43 (s, 2 H), 4.10 (s, 4 H), 4.22 (sept, J = 6.6 Hz, 1 H), 4.35 (s, 2 H), 6.61 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 6.88 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.14 (dd, J = 6.0, 3.0 Hz, 2 H), 7.29 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 7.41 (d, J = 1.1 Hz, 1 H), 7.52 (dd, J = 5.8, 3.2 Hz, 1 H), 7.59 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 7.69 (d, J = 1.5 Hz, 1 H), 12.43 (br s, 1 H).

表 17-63

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
4-15	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.76 (t, J = 7.17 Hz, 6H), 0.98–1.16 (m, 4H), 1.23 (s, 9H), 1.34–1.56 (m, 4H), 2.38–2.46(m, 1H), 3.39 (s, 2H), 4.05 (s, 2H), 4.10 (s, 2H), 5.02 (s, 2H), 6.89 (d, J = 8.60 Hz, 2H), 7.03 (d, J = 8.60 Hz, 2H), 7.14 (s, 1H), 7.41 (s, 1H), 7.43 (d, J = 8.31 Hz, 2H), 7.66 (d, J = 8.31 Hz, 2H), 7.76 (s, 1H)
4-16	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.76 (t, J = 7.14 Hz, 6H), 0.97–1.11 (m, 4H), 1.34–1.55 (m, 4H), 2.36–2.46(m, 1H), 3.45 (s, 2H), 3.52 (s, 2H), 4.07 (s, 2H), 5.02 (s, 2H), 6.89 (d, J = 8.67 Hz, 2H), 7.01(d, J = 6.39 Hz, 1H), 7.03 (d, J = 8.67 Hz, 2H), 7.28 (dd, J = 8.28, 7.53 Hz, 2H), 7.42 (d, J = 8.28 Hz, 2H), 7.43 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 7.57 (d, J = 7.53 Hz, 2H), 7.65 (d, J = 8.31 Hz, 2H), 7.75 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 9.93 (s, 1H)
4-17	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.67(t, J = 4.0Hz, 6H), 1.14(d,J = 8.0Hz, 6H), 1.39–1.43(m,2H), 1.50–1.60(m,2H), 2.08–2.15(m,1H), 4.34(s,2H), 5.44(s,2H), 6.59(d,J = 8.0Hz, 2H), 6.87(d,J = 12.0Hz, 2H), 7.22(d,J = 4.0Hz, 1H), 7.30(d,J = 8.0Hz, 2H), 7.36(d,J = 4.0Hz, 1H), 7.56(d,J = 8.0Hz, 2H), 7.85(s,1H), 8.82(s,1H), 8.66(s,1H)
4-18	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.77(t, J = 8.0Hz, 6H), 1.02–1.10(m,4H), 1.14(d,J = 4.0Hz, 6H), 1.31–1.50(m,4H), 2.29–2.37(m,1H), 4.15–4.26(m,1H), 4.33(s,2H), 5.43(s,2H), 6.58(d,J = 12.0Hz, 2H), 6.87(d,J = 12.0Hz, 2H), 7.22(s,1H), 7.30(d,J = 8.0Hz, 1H), 7.36(d,J = 4.0Hz, 2H), 7.56(d,J = 8.0Hz, 2H), 7.84(s,1H), 8.51(s,1H), 8.65(s,1H)
4-19	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.63(t, J = 8.0Hz, 6H), 1.10(d,J = 8.0Hz, 6H), 1.21(s,9H), 1.33–1.38(m,2H), 1.45–1.52(m,2H), 2.27(m,1H), 3.25–3.60(m,1H), 3.98(s,2H), 4.06(s,2H), 4.29(s,2H), 6.55(d,J = 8.0Hz, 2H), 6.82(d,J = 8.0Hz, 2H), 6.92(d,J = 4.0Hz, 1H), 7.10(s,1H), 7.25(d,J = 12.0Hz, 2H), 7.24(s,1H), 7.49(d,J = 8.0Hz, 2H)

表 17-64

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
4-20	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.78(t, J = 9.0Hz, 6H), 1.01-1.13(m, 4H), 1.15(d, J = 6.0Hz, 6H), 1.26(s, 9H), 1.38-1.49(m, 4H), 2.28-2.35(m, 1H), 3.33(s, 2H), 4.06(s, 2H), 4.13(s, 2H), 4.14-4.24(m, 1H), 4.34(s, 2H), 6.60(d, J = 9.0Hz, 2H), 6.89(d, J = 9.0Hz, 2H), 6.96(d, J = 6.0Hz, 1H), 7.13(s, 1H), 7.29(d, J = 12.0Hz, 2H), 7.29(s, 1H), 7.54(d, J = 6.0Hz, 2H)
4-21	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.67(t, J = 4.0Hz, 6H), 1.14(d, J = 8.0Hz, 6H), 1.30-1.43(m, 2H), 1.48-1.60(m, 2H), 2.06-2.14(m, 1H), 3.40(s, 2H), 4.06(s, 2H), 4.07(s, 2H), 4.18-4.25(m, 1H), 4.33(s, 2H), 6.59(d, J = 8.0Hz, 2H), 6.86(d, J = 8.0Hz, 2H), 7.00(d, J = 4.0Hz, 1H), 7.12-7.14(m, 2H), 7.28(m, 3H), 7.48-7.54(m, 3H)
4-22	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.78(t, J = 9.0Hz, 6H), 1.01-1.14(m, 4H), 1.15(d, J = 6.0Hz, 6H), 1.36-1.48(m, 4H), 2.24-2.40(m, 1H), 4.07(s, 4H), 4.17-4.25(m, 1H), 4.34(s, 2H), 6.60(d, J = 6.0Hz, 2H), 6.89(d, J = 9.0Hz, 2H), 6.97-7.43(m, 6H), 7.43-7.69(m, 3H)
4-23	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.79(t, J = 7.3 Hz, 6H), 1.01-1.14(m, 4H), 1.39-1.56(m, 4H), 2.20(s, 3H), 2.29(s, 3H), 2.41-2.49(m, 1H), 3.37(s, 2H), 4.04(s, 2H), 4.08(s, 2H), 5.05(s, 2H), 6.91(d, J = 8.6 Hz, 2H), 7.05(d, J = 8.6 Hz, 2H), 7.42(s, 1H), 7.45(d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.68(d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.77(s, 1H)
4-24	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.68(t, J = 7.2 Hz, 6H), 1.15(d, J = 6.3 Hz, 6H), 1.34-1.45(m, 2H), 1.51-1.61(m, 2H), 2.09-2.16(m, 1H), 3.04-3.17(m, 2H), 3.83-3.96(m, 2H), 4.00-4.09(m, 1H), 4.16-4.27(m, 3H), 4.34(s, 2H), 6.60(d, J = 8.6 Hz, 2H), 6.87(d, J = 8.6 Hz, 2H), 7.00-7.16(m, 4H), 7.29(d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.45(brs, 3H), 7.61(d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.71(brs, 1H)

表 17-65

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
4-25	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.68(t, J = 7.3 Hz, 6H), 1.15(d, J = 7.0 Hz, 6H), 1.17(d, J = 7.0 Hz, 6H), 1.34-1.45(m, 2H), 1.50-1.60(m, 2H), 2.08-2.16(m, 1H), 2.82(sep, J = 7.0 Hz, 1H), 3.45(s, 2H), 3.53(s, 2H), 4.08(s, 2H), 4.21(sep, J = 7.0 Hz, 1H), 4.34(s, 2H), 6.60(d, J = 8.6 Hz, 2H), 6.87(d, J = 8.6 Hz, 2H), 7.16(d, J = 8.6 Hz, 2H), 7.28(d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.41(s, 1H), 7.50(d, J = 8.6 Hz, 2H), 7.57(d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.69(s, 1H), 9.85(s, 1H), 12.58(brs, 1H)
4-26	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.79(t, J=7.4Hz, 6H), 1.00-1.14(m, 4H), 1.39-1.56(m, 4H), 2.42-2.48(m, 1H), 3.17-3.43(m, 2H), 4.15-4.63(m, 5H), 5.07(s, 2H), 6.92(d, J=8.8Hz, 2H), 7.06(d, J=8.8Hz, 2H), 7.18-7.28(m, 5H), 7.48-7.50(m, 3H), 7.67(d, J=8.4Hz, 2H)
4-27	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79 (t, J = 7.2 Hz, 6 H), 0.99- 1.18 (m, 4 H), 1.18 (d, J = 6.8 Hz, 6 H), 1.32- 1.60 (m, 4 H), 2.39- 2.55 (m, 1 H), 2.75- 2.91 (m, 1 H), 3.47 (s, 2 H), 3.55 (s, 2 H), 4.10 (s, 2 H), 5.06 (s, 2 H), 6.93 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.07 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.18 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.42- 7.53 (m, 5 H), 7.68 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 7.79 (d, J = 1.5 Hz, 1 H), 9.87 (s, 1 H), 12.50 (br s, 1 H).
4-28	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.68(t, J = 7.3 Hz, 6H), 1.14(d, J = 6.6 Hz, 6H), 1.32-1.47(m, 2H), 1.49-1.62(m, 2H), 2.08-2.17(m, 1H), 3.04(dd, J = 16.3, 3.5 Hz, 1H), 3.11(dd, J = 16.3, 6.2 Hz, 1H), 3.81-3.86(m, 2H), 4.00(d, J = 15.8 Hz, 1H), 4.14-4.26(m, 3H), 4.34(s, 2H), 6.60(d, J = 8.4 Hz, 2H), 6.88(d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.00-7.14(m, 5H), 7.28-7.31(m, 3H), 7.54(d, J = 8.0 Hz, 2H), 12.47(brs, 1H)
4-29	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79(t, J = 7.1 Hz, 6H), 1.01-1.14(m, 4H), 1.25(s, 9H), 1.38-1.58(m, 4H), 2.41-2.50(m, 1H), 3.39(s, 2H), 3.95(s, 2H), 4.03(s, 2H), 5.06(s, 2H), 6.75(s, 1H), 6.93(d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.07(d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.40(s, 1H), 7.47(d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.69(d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.78(s, 1H), 12.40(brs, 1H)

表 17-66

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
4-30	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.79(t, J = 7.3 Hz, 6H), 1.00–1.14(m, 4H), 1.39–1.56(m, 4H), 2.41–2.49(m, 1H), 3.36(s, 2H), 3.86(s, 3H), 4.06(s, 2H), 4.17(s, 2H), 5.05(s, 2H), 6.91(d, J = 8.6 Hz, 2H), 7.05(d, J = 8.8 Hz, 2H), 7.16(t, J = 7.4 Hz, 1H), 7.23(t, J = 7.4 Hz, 1H), 7.41(s, 1H), 7.44(d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.52(d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.59(d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.65(d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.75(s, 1H)
4-31	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79(t, J=7.2Hz, 6H), 0.99–1.14(m, 4H), 1.38–1.59(m, 4H), 2.41–2.46(m, 1H), 5.06(s, 2H), 5.62(s, 2H), 6.92(d, J=8.4Hz, 2H), 7.05–7.11(m, 3H), 7.30(d, J=3.6Hz, 1H), 7.42(d, J=3.3Hz, 1H), 7.48(d, J=8.1Hz, 2H), 7.65(d, J=7.8Hz, 2H), 7.71(d, J=7.2Hz, 1H), 7.90(dd, J=8.1, 7.2Hz, 1H)
4-32	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.69 (t, J = 7.17 Hz, 6H), 1.16 (d, J = 6.59 Hz, 6H), 1.35–1.47 (m, 2H), 1.48–1.63 (m, 2H), 2.07–2.18 (m, 1H), 4.22 (quint, J = 6.59 Hz, 1H), 4.35 (s, 2H), 5.53 (s, 2H), 6.62 (d, J = 8.66 Hz, 2H), 6.68 (dd, J = 8.10, 0.75 Hz, 1H), 6.88 (d, J = 8.66 Hz, 2H), 7.30 (d, J = 8.28 Hz, 2H), 7.41 (dd, J = 7.14, 0.75 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 8.10, 7.14 Hz, 1H), 7.64 (d, J = 8.28 Hz, 2H), 7.76 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 7.78 (d, J = 1.5 Hz, 1H)
4-33	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.68(t, J = 7.1 Hz, 6H), 1.14(d, J = 6.8 Hz, 6H), 1.33(s, 9H), 1.35–1.60(m, 4H), 2.07–2.18(m, 1H), 3.41(s, 2H), 4.08(s, 4H), 4.22(sep, J = 6.6 Hz, 1H), 4.35(s, 2H), 6.61(d, J = 8.8 Hz, 2H), 6.88(d, J = 8.8 Hz, 2H), 7.30(d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.39(s, 1H), 7.41(s, 1H), 7.60(d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.72(s, 1H), 12.48(brs, 1H)
4-34	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.68(t, J = 7.3 Hz, 6H), 1.15(d, J = 6.6 Hz, 6H), 1.32–1.47(m, 2H), 1.49–1.62(m, 2H), 2.08–2.17(m, 1H), 3.37(s, 2H), 3.86(s, 3H), 4.06(s, 2H), 4.17(s, 2H), 4.22(sep, J = 6.6 Hz, 1H), 4.34(s, 2H), 6.61(d, J = 8.8 Hz, 2H), 6.88(d, J = 8.8 Hz, 2H), 7.16–7.30(m, 4H), 7.38(brs, 1H), 7.52–7.61(m, 4H), 7.67(brs, 1H)

表 17-67

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
4-35	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.79(t, J=7.4Hz, 6H), 1.01-1.14(m, 4H), 1.27(s, 9H), 1.39-1.56(m, 4H), 2.41-2.48(m, 1H), 3.42(s, 2H), 4.13(s, 2H), 5.06(s, 2H), 6.92(d, J=8.8Hz, 2H), 7.00(d, J=3.6Hz, 1H), 7.06(d, J=8.4Hz, 2H), 7.16(s, 1H), 7.36(d, J=3.6Hz, 1H), 7.46(d, J=8.4Hz, 2H), 7.63(d, J=8.4Hz, 2H)
4-36	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.69(t, J=7.2Hz, 6H), 1.15(d, J=6.6Hz, 6H), 1.32-1.63(m, 4H), 2.07-2.18(m, 1H), 3.36(s, 2H), 3.87(s, 3H), 4.03(s, 2H), 4.16(s, 2H), 4.18-4.26(m, 1H), 4.34(s, 2H), 6.61(d, J=8.7Hz, 2H), 6.89(d, J=8.4Hz, 2H), 6.99(d, J=3.6Hz, 1H), 7.16-7.31(m, 5H), 7.53(brd, J=8.4Hz, 3H), 7.60(d, J=7.2Hz, 1H)
4-37	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.80(t, J=7.3Hz, 6H), 0.98-1.16(m, 4H), 1.34(s, 9H), 1.37-1.59(m, 4H), 2.39-2.53(m, 1H), 3.41(s, 2H), 4.06(s, 2H), 4.10(s, 2H), 5.07(s, 2H), 6.93(d, J=7.9Hz, 2H), 7.01(d, J=3.0Hz, 1H), 7.07(d, J=8.3Hz, 2H), 7.37(d, J=3.4Hz, 1H), 7.41-7.43(m, 1H), 7.48(d, J=7.9Hz, 2H), 7.64(d, J=7.9Hz, 2H), 12.51(brs, 1H)
4-38	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79(t, J=7.3Hz, 6H), 0.98-1.17(m, 4H), 1.36-1.59(m, 4H), 2.39-2.54(m, 1H), 2.94(s, 2H), 3.91(s, 2H), 4.03(s, 3H), 4.16(s, 2H), 5.05(s, 2H), 6.86-6.98(m, 3H), 7.06(d, J=8.7Hz, 2H), 7.12-7.26(m, 2H), 7.30(d, J=3.4Hz, 1H), 7.44(d, J=8.3Hz, 2H), 7.51(d, J=7.2Hz, 1H), 7.55-7.63(m, 3H)
4-39	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79(t, J=7.3Hz, 6H), 0.97-1.17(m, 4H), 1.34-1.60(m, 4H), 2.37-2.55(m, 1H), 3.02(brs, 2H), 3.95(brs, 5H), 4.14(brs, 2H), 5.04(brs, 2H), 6.91(brd, J=8.3Hz, 3H), 7.06(d, J=8.6Hz, 2H), 7.10-7.27(m, 2H), 7.27-7.35(m, 1H), 7.35-7.68(m, 6H)

表 17-68

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
4-40	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79(t, J=7.3Hz, 6H), 0.95-1.20(m, 4H), 1.32-1.60(m, 4H), 2.28(s, 3H), 2.40-2.54(m, 1H), 3.62(s, 2H), 4.00(s, 3H), 4.19(s, 2H), 4.46(s, 2H), 5.05(s, 2H), 6.92(d, J=8.6Hz, 2H), 6.98-7.14(m, 5H), 7.25(d, J=3.6Hz, 1H), 7.36-7.58(m, 8H), 7.76(d, J=9.0Hz, 1H), 7.89(d, J=9.0Hz, 1H)
4-41	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.80(t, J=7.3Hz, 6H), 0.98-1.15(m, 4H), 1.38-1.59(m, 4H), 2.39-2.54(m, 1H), 5.07(s, 2H), 5.52(s, 2H), 6.93(d, J=8.6Hz, 2H), 7.07(d, J=8.7Hz, 2H), 7.49(d, J=8.3Hz, 2H), 7.71(s, 1H), 7.72(d, J=6.4Hz, 2H), 7.93(d, J=1.5Hz, 1H), 8.00(brs, 1H), 8.65-8.67(m, 1H), 8.73-8.76(m, 1H)
4-42	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79(t, J=7.3Hz, 6H), 1.00-1.14(m, 4H), 1.37-1.60(m, 4H), 2.40-2.54(m, 1H), 3.80(brs, 3H), 4.08-4.62(m, 2H), 4.92-5.36(m, 4H), 6.92(d, J=8.6Hz, 2H), 7.07(d, J=8.7Hz, 2H), 7.16-7.80(m, 10H)
4-43	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79(t, J=7.3Hz, 6H), 0.93-1.15(m, 4H), 1.16-1.60(m, 13H), 2.36-2.55(m, 1H), 4.16(brs, 2Hx0.45), 4.43(brs, 2Hx0.55), 4.70-5.25(m, 4H), 6.93(d, J=8.4Hz, 2H), 7.07(d, J=8.4Hz, 2H), 7.29-7.62(m, 5H), 7.72-7.75(m, 2H)
4-44	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79(t, J=7.3Hz, 6H), 0.97-1.15(m, 4H), 1.20(d, J=6.8Hz, 6H), 1.35-1.59(m, 4H), 2.39-2.54(m, 1H), 2.81-2.96(m, 1H), 4.01(brs, 2Hx0.60), 4.23(brs, 2Hx0.40), 4.63(brs, 2Hx0.40), 4.88(brs, 2Hx0.60), 5.08(s, 2H), 6.92(d, J=8.7Hz, 2H), 7.06(d, J=8.7Hz, 2H), 7.16-7.40(m, 5H), 7.41-7.56(m, 3H), 7.71(d, J=7.9Hz, 2H)
4-45	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79(t, J=7.2Hz, 6H), 0.97-1.19(m, 4H), 1.35-1.60(m, 4H), 2.37-2.56(m, 1H), 2.89(s, 6H), 3.84-4.30(m, 2H), 4.40-4.93(m, 2H), 5.09(s, 2H), 6.73(brd, J=7.2Hz, 2H), 6.93(d, J=8.6Hz, 2H), 7.07(d, J=8.7Hz, 2H), 7.15(brd, J=7.9Hz, 2H), 7.31(d, J=3.8Hz, 1H), 7.44-7.57(m, 3H), 7.72(d, J=8.3Hz, 2H)
4-46	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79(t, J=7.2Hz, 6H), 0.95-1.18(m, 4H), 1.35-1.61(m, 4H), 2.39-2.55(m, 1H), 4.11(brs, 2Hx0.62), 4.46(brs, 2Hx0.38), 4.77(brs, 2Hx0.38), 4.99(brs, 2Hx0.62), 5.08(s, 2H), 6.92(d, J=8.7Hz, 2H), 7.07(d, J=8.7Hz, 2H), 7.25-7.60(m, 6H), 7.61-7.92(m, 3H), 8.42-8.72(m, 1H)

表 17-69

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
4-47	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79(t, J=7.4Hz, 6H), 0.97-1.18(m, 4H), 1.34-1.60(m, 4H), 2.37-2.55(m, 1H), 3.94-4.50(m, 2H), 4.59-5.07(m, 2H), 5.09(s, 2H), 6.93(d, J=8.7Hz, 2H), 7.07(d, J=8.7Hz, 2H), 7.19-7.58(m, 5H), 7.72(d, J=7.9Hz, 2H), 7.79(d, J=7.5Hz, 1H), 8.51(d, J=4.5Hz, 1H), 8.58(s, 1H)
4-48	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.80(t, J=7.3Hz, 6H), 1.00-1.15(m, 4H), 1.38-1.58(m, 4H), 2.40(s, 3H), 2.42-2.50(m, 1H), 5.07(s, 2H), 5.53(s, 2H), 6.93(d, J=8.6Hz, 2H), 7.07(d, J=8.6Hz, 2H), 7.49(d, J=8.3Hz, 2H), 7.71-7.75(m, 3H), 7.93(d, J=1.5Hz, 1H), 8.04(brs, 1H), 8.69(d, J=2.6Hz, 1H), 8.76(d, J=1.5Hz, 1H)
4-49	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79 (t, J = 7.3 Hz, 6 H), 0.97- 1.18 (m, 4 H), 1.35- 1.61 (m, 4 H), 2.39- 2.53 (m, 1 H), 3.09 (s, 3 H), 3.91 (s, 2 H), 4.62 (s, 2 H), 5.07 (s, 2 H), 6.93 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.03- 7.12 (m, 3 H), 7.39 (d, J = 3.8 Hz, 1 H), 7.48 (d, J = 8.5 Hz, 2 H), 7.66 (d, J = 8.5 Hz, 2 H), 12.95 (br s, 1 H).
4-50	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.80(t, J=7.3Hz, 6H), 0.99-1.17(m, 4H), 1.37-1.58(m, 4H), 2.40-2.54(m, 1H), 5.07(s, 2H), 5.39(s, 2H), 6.93(d, J=8.3Hz, 2H), 7.07(d, J=8.6Hz, 2H), 7.48(d, J=8.3Hz, 2H), 7.67(brs, 1H), 7.72(d, J=8.3Hz, 2H), 7.79(dd, J=1.5, 3.0Hz, 1H), 7.89(d, J=1.5Hz, 1H), 8.26(d, J=3.0Hz, 1H), 8.60(d, J=1.1Hz, 1H)
4-51	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.80(t, J=7.3Hz, 6H), 1.00-1.15(m, 4H), 1.38-1.58(m, 4H), 2.39-2.54(m, 1H), 5.07(s, 2H), 5.52(s, 2H), 6.93(d, J=8.6Hz, 2H), 7.07(d, J=8.6Hz, 2H), 7.49(d, J=8.3Hz, 2H), 7.71(s, 1H), 7.72(d, J=6.8Hz, 2H), 7.93(d, J=1.5Hz, 1H), 7.99(brs, 1H), 8.65-8.67(m, 1H), 8.73-8.75(m, 1H)
4-52	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.80(t, J=7.3Hz, 6H), 0.97-1.19(m, 4H), 1.36-1.62(m, 4H), 2.40-2.55(m, 1H), 3.45(brs, 4H), 3.84(brs, 4H), 5.10(s, 2H), 6.96(dd, J=8.7, 12.8Hz, 4H), 7.08(d, J=8.3Hz, 2H), 7.46-7.59(m, 4H), 7.78(dd, J=8.3, 15.5Hz, 4H)
4-53	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79(t, J=7.2Hz, 6H), 0.98-1.19(m, 4H), 1.36-1.59(m, 4H), 1.60-1.80(m, 2H), 1.88(brd, J=11.3Hz, 2H), 2.40-2.54(m, 1H), 2.88-3.02(m, 1H), 3.03-3.22(m, 2H), 4.46(brd, J=13.2Hz, 2H), 5.09(s, 2H), 6.93(d, J=8.7Hz, 2H), 7.07(d, J=8.7Hz, 2H), 7.38-7.58(m, 6H), 7.74(d, J=8.3Hz, 2H), 7.89(d, J=8.3Hz, 2H)

表 17-70

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
4-54	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79 (t, J = 7.4 Hz, 6 H), 0.98– 1.18 (m, 4 H), 1.36– 1.60 (m, 4 H), 2.39– 2.53 (m, 1 H), 3.64 (s, 2 H), 3.99 (s, 3 H), 4.21 (s, 2 H), 4.48 (s, 2 H), 5.06 (s, 2 H), 6.93 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.07 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.40– 7.68 (m, 8 H), 7.71– 7.76 (m, 1 H), 7.85– 7.91 (m, 1 H).
4-55	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79(t, J=7.3Hz, 6H), 0.98–1.18(m, 4H), 1.36–1.59(m, 4H), 2.40–2.50(m, 1H), 3.64(s, 2H), 3.99(s, 3H), 4.22(s, 2H), 4.48(s, 2H), 5.06(s, 2H), 6.93(d, J=8.8Hz, 2H), 7.07(d, J=8.8Hz, 2H), 7.42–7.63(m, 7H), 7.66(s, 1H), 7.75(d, J=8.0Hz, 1H), 7.89(d, J=8.8Hz, 1H)
4-56	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79 (t, J = 7.2 Hz, 6 H), 0.96– 1.18 (m, 4 H), 1.35– 1.60 (m, 4 H), 2.33 (s, 6 H), 2.38– 2.54 (m, 1 H), 5.07 (s, 2 H), 5.51 (s, 2 H), 6.93 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.07 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.49 (d, J = 7.9 Hz, 2 H), 7.60– 7.78 (m, 5 H), 7.93 (d, J = 1.1 Hz, 1 H), 8.35 (d, J = 8.3 Hz, 1 H), 9.99 (s, 1 H), 12.76 (br s, 1 H).
4-57	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.80 (t, J = 7.2 Hz, 6 H), 0.97– 1.16 (m, 4 H), 1.10 (d, J = 6.8 Hz, 6 H), 1.35– 1.60 (m, 4 H), 2.39– 2.53 (m, 1 H), 2.71– 2.87 (m, 1 H), 5.07 (s, 2 H), 5.48 (s, 2 H), 6.93 (d, J = 8.6 Hz, 2 H), 7.07 (d, J = 8.6 Hz, 2 H), 7.49 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 7.56 (dd, J = 8.6, 1.4 Hz, 1 H), 7.66– 7.73 (m, 4 H), 7.90 (d, J = 1.4 Hz, 1 H), 8.11 (d, J = 8.6 Hz, 1 H), 9.10 (s, 1 H), 12.85 (br s, 1 H).
4-58	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.80 (t, J = 7.2 Hz, 6 H), 0.97– 1.18 (m, 4 H), 1.34– 1.61 (m, 4 H), 2.38– 2.54 (m, 1 H), 5.07 (s, 2 H), 5.40 (s, 2 H), 6.93 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.07 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.14 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.49 (d, J = 7.9 Hz, 2 H), 7.68– 7.75 (m, 3 H), 7.87– 7.94 (m, 3 H), 12.66 (br s, 1 H).
4-59	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.80 (t, J = 7.2 Hz, 6 H), 0.98– 1.18 (m, 4 H), 1.36– 1.59 (m, 4 H), 2.39– 2.54 (m, 1 H), 2.99 (s, 3 H), 3.18 (s, 3 H), 5.07 (s, 2 H), 5.51 (s, 2 H), 6.93 (d, J = 8.5 Hz, 2 H), 7.07 (d, J = 8.5 Hz, 2 H), 7.43 (d, J = 8.0 Hz, 1 H), 7.49 (d, J = 8.1 Hz, 2 H), 7.58 (dd, J = 8.0, 1.5 Hz, 1 H), 7.70 (s, 1 H), 7.71 (d, J = 8.1 Hz, 2 H), 7.78 (d, J = 1.5 Hz, 1 H), 7.92 (s, 1 H), 13.17 (br s, 1 H).

表 17-71

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
4-60	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79 (t, J = 7.2 Hz, 6 H), 0.98– 1.18 (m, 4 H), 1.35– 1.60 (m, 4 H), 2.39– 2.54 (m, 1 H), 4.63 (s, 2 H), 5.06 (s, 2 H), 6.93 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.06 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.42– 7.54 (m, 5 H), 7.66 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 7.73 (d, J = 1.1 Hz, 1 H), 7.86 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 12.90 (br s, 1 H).
4-61	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.80 (t, J = 7.3 Hz, 6 H), 0.99– 1.19 (m, 4 H), 1.36– 1.60 (m, 4 H), 2.40– 2.54 (m, 1 H), 5.07 (s, 2 H), 5.33 (s, 2 H), 5.54 (s, 2 H), 6.67 (d, J = 8.0 Hz, 1 H), 6.93 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.07 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.39 (dd, J = 8.0, 1.6 Hz, 1 H), 7.45– 7.52 (m, 3 H), 7.65– 7.76 (m, 3 H), 7.88 (d, J = 1.6 Hz, 1 H), 12.11 (br s, 1 H).
4-62	DMSO-d ₆ , 400MHz	1.11–1.41(m, 5H), 1.61–1.81(m, 5H), 2.00–3.68(m, 9H), 4.30–4.76(m, 2H), 5.41(s, 2H), 7.09–7.44(m, 13H), 7.57(d, J=7.9Hz, 1H), 7.88(d, J=7.9Hz, 1H), 7.96(s, 1H)
4-63	DMSO-d ₆ , 300MHz	1.12–1.44(m, 5H), 1.60–1.83(m, 5H), 2.37–2.48(m, 1H), 3.28(s, 2H), 3.83(s, 2H), 4.00(s, 2H), 5.40(s, 2H), 6.97(d, J=3.7Hz, 1H), 7.11–7.44(m, 12H), 7.52–7.57(m, 1H), 7.85–7.90(m, 1H), 7.88(s, 1H), 12.35(brs, 1H)
4-64	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79(t, J=7.3Hz, 6H), 0.99–1.15(m, 4H), 1.38–1.59(m, 4H), 2.39–2.53(m, 1H), 3.18(s, 3H), 3.85(s, 2H), 4.65(s, 2H), 5.07(s, 2H), 6.93(d, J=8.7Hz, 2H), 7.07(d, J=8.6Hz, 2H), 7.25–7.35(m, 1H), 7.39–7.43(m, 4H), 7.45–7.51(m, 3H), 7.68(d, J=8.2Hz, 2H), 7.84(d, J=1.6Hz, 1H)
4-65	DMSO-d ₆ , 300MHz	1.08–1.39(m, 5H), 1.27(s, 9H), 1.61–1.77(m, 5H), 2.34–2.47(m, 1H), 3.16(brs, 2H), 3.35(brs, 3H), 4.01(brs, 2H), 4.08(brs, 2H), 6.97(brd, J=2.6Hz, 1H), 7.06(brd, J=8.7Hz, 2H), 7.10(brd, J=8.7Hz, 2H), 7.24(brd, J=8.7Hz, 2H), 7.32(brd, J=3.0Hz, 1H), 7.37–7.43(m, 3H)

表 17-72

实施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
4-66	DMSO-d ₆ , 300MHz	1.08-1.45(m, 5H), 1.13(t, J=7.0Hz, 3H), 1.62-1.84(m, 5H), 2.38-2.54(m, 1H), 3.32(s, 2H), 3.48(q, J=6.9Hz, 2H), 3.92(s, 2H), 3.97(s, 2H), 4.51(s, 2H), 6.67(d, J=8.7Hz, 2H), 6.88(d, J=3.4Hz, 2H), 7.04(d, J=3.8Hz, 2H), 7.12(d, J=8.7Hz, 2H), 7.16(d, J=8.3Hz, 2H), 7.24-7.28(m, 1H), 7.36(d, J=8.7Hz, 2H), 7.54(d, J=7.5Hz, 1H), 7.77-7.83(m, 1H), 8.48(d, J=4.1Hz, 1H), 12.45(brs, 1H)
4-67	DMSO-d ₆ , 300MHz	1.09-1.44(m, 5H), 1.13(t, J=7.0Hz, 3H), 1.64-1.82(m, 5H), 2.38-2.51(m, 1H), 3.03(t, J=5.8Hz, 2H), 3.47(q, J=7.1Hz, 2H), 3.44(s, 2H), 4.05(t, J=7.2Hz, 2H), 4.03(s, 2H), 4.51(s, 2H), 6.65(s, 2H), 6.68(s, 2H), 6.85-6.94(m, 4H), 7.03(d, J=3.4Hz, 1H), 7.12(d, J=8.3Hz, 2H), 7.16(d, J=8.3Hz, 2H), 7.26(t, J=7.9Hz, 2H), 7.35(d, J=8.7Hz, 2H), 12.31(brs, 1H)
4-68	DMSO-d ₆ , 300MHz	1.02-1.47(m, 4H), 1.08(t, J=6.8Hz, 3H), 1.24(s, 9H), 1.61-1.87(m, 9H), 2.05-2.16(m, 2H), 2.38-2.47(m, 1H), 2.53-2.65(m, 1H), 3.02(brd, J=11.3Hz, 2H), 3.16(brd, J=6.4Hz, 2H), 3.41(q, J=6.9Hz, 2H), 3.72(s, 2H), 6.68(d, J=8.7Hz, 2H), 7.12(d, J=8.3Hz, 2H), 7.23-7.30(m, 3H), 7.38(d, J=7.9Hz, 2H), 7.42(s, 1H), 7.46(d, J=8.3Hz, 2H), 7.87(d, J=8.3Hz, 2H), 12.78(brs, 1H)
4-69	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79(t, J=7.4Hz, 6H), 1.01-1.21(m, 4H), 1.15(d, J=7.2Hz, 6H), 1.37-1.59(m, 4H), 2.40-2.51(m, 1H), 2.72-2.87(m, 1H), 3.95(s, 2H), 4.65(s, 2Hx0.75), 4.74(s, 2Hx0.75), 4.85(s, 2Hx0.25), 4.91(s, 2Hx0.25), 5.05(s, 2H), 6.79-6.86(m, 2H), 6.92(d, J=8.3Hz, 2H), 7.03-7.13(m, 4H), 7.42-7.57(m, 3H), 7.62-7.85(m, 3H)
4-70	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79(t, J=7.2Hz, 6H), 0.99-1.15(m, 4H), 1.21(d, J=6.8Hz, 6H), 1.37-1.58(m, 4H), 2.40-2.51(m, 1H), 2.86-3.00(m, 1H), 3.93(s, 2Hx0.5), 4.08(s, 2Hx0.5), 4.69(s, 2Hx0.5), 4.81(s, 2Hx0.5), 5.07(s, 2H), 6.93(d, J=8.7Hz, 2H), 7.07(d, J=8.7Hz, 2H), 7.26-7.61(m, 7H), 7.71(d, J=7.9Hz, 2H), 7.81(s, 1H)
4-71	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79(t, J=7.3Hz, 6H), 0.84(d, J=6.8Hz, 6H), 1.00-1.17(m, 4H), 1.29-1.65(m, 7H), 2.41-2.51(m, 1H), 2.63(t, J=7.3Hz, 2H), 3.30(s, 2H), 3.99(s, 2H), 5.06(s, 2H), 6.93(d, J=8.7Hz, 2H), 7.07(d, J=8.7Hz, 2H), 7.40(brs, 1H), 7.46(d, J=8.3Hz, 2H), 7.69(d, J=8.3Hz, 2H), 7.76(d, J=1.1Hz, 1H), 12.22(brs, 1H)

表 17-73

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
4-72	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79(t, J=7.3Hz, 6H), 0.97-1.16(m, 4H), 1.37-1.58(m, 4H), 2.39-2.50(m, 1H), 3.11(s, 3H), 3.70(s, 2H), 4.46(s, 2H), 5.06(s, 2H), 6.93(d, J=8.7Hz, 2H), 7.06(d, J=8.3Hz, 2H), 7.14(t, J=7.2Hz, 1H), 7.25-7.41(m, 5H), 7.47(d, J=8.3Hz, 2H), 7.66(d, J=8.3Hz, 2H), 7.75(d, J=1.1Hz, 1H), 11.96(brs, 1H)
4-73	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79(t, J=7.4Hz, 6H), 1.00-1.15(m, 4H), 1.36-1.58(m, 4H), 2.41-2.50(m, 1H), 2.74(br, 2H), 2.85(br, 2H), 3.72(s, 2H), 3.91(s, 2H), 5.09(s, 2H), 6.95(d, J=8.3Hz, 2H), 7.07(d, J=8.3Hz, 2H), 7.23(d, J=7.9Hz, 1H), 7.34-7.46(m, 3H), 7.48(s, 1H), 7.61-7.73(m, 3H), 7.79(s, 2H), 12.74(br, 1H)
4-74	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.91(d, J=6.4Hz, 3H), 0.98-1.13(m, 2H), 1.34-1.52(m, 3H), 1.71-1.82(m, 4H), 2.38-2.49(m, 1H), 2.51(br, 4H), 3.27(br, 4H), 3.72(s, 2H), 5.07(s, 2H), 6.92-6.98(m, 3H), 7.03(d, J=9.0Hz, 2H), 7.21(s, 1H), 7.23(d, J=8.3Hz, 2H), 7.35(d, J=8.3Hz, 2H), 7.54(d, J=8.7Hz, 2H), 7.76(d, J=8.7Hz, 2H), 12.25(s, 1H)
4-75	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79(t, J=7.2Hz, 6H), 1.01-1.14(m, 4H), 1.38-1.58(m, 4H), 2.41-2.49(m, 1H), 3.41(s, 2H), 4.04(s, 2H), 5.06(s, 2H), 6.92(d, J=8.7Hz, 2H), 6.98(d, J=3.8Hz, 1H), 7.07(d, J=8.7Hz, 2H), 7.34(d, J=3.8Hz, 1H), 7.47(d, J=8.3Hz, 2H), 7.60(d, J=8.3Hz, 2H), 7.63-7.69(m, 2H), 8.06(s, 1H), 12.47(br, 1H)
4-76	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79(t, J=7.3Hz, 6H), 1.00-1.14(m, 4H), 1.38-1.57(m, 4H), 2.39-2.50(m, 1H), 3.29(s, 2H), 3.88(s, 2H), 4.00(s, 2H), 5.07(s, 2H), 6.93(d, J=8.7Hz, 2H), 7.00(d, J=3.4Hz, 1H), 7.07(d, J=8.7Hz, 2H), 7.37(d, J=3.4Hz, 1H), 7.47(d, J=8.3Hz, 2H), 7.51(d, J=8.3Hz, 2H), 7.65(d, J=8.3Hz, 2H), 7.93(d, J=8.3Hz, 2H), 12.52(br, 2H)
4-77	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79(t, J=7.3Hz, 6H), 1.01-1.16(m, 4H), 1.38-1.58(m, 4H), 2.40-2.50(m, 1H), 3.23(s, 2H), 3.70(br, 5H), 3.97(s, 2H), 5.07(s, 2H), 6.88-6.96(m, 4H), 6.98(d, J=3.8Hz, 1H), 7.07(d, J=8.7Hz, 2H), 7.28(d, J=8.7Hz, 2H), 7.36(d, J=3.4Hz, 1H), 7.47(d, J=8.7Hz, 2H), 7.65(d, J=8.3Hz, 2H), 12.11(br, 1H)

表 17-74

实施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
4-78	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79(t, J=7.4Hz, 6H), 1.01-1.16(m, 4H), 1.38-1.58(m, 4H), 2.46(s, 3H), 3.25(s, 2H), 3.75(s, 2H), 3.98(s, 2H), 5.07(s, 2H), 6.93(d, J=8.7Hz, 2H), 6.99(d, J=3.4Hz, 1H), 7.07(d, J=8.7Hz, 2H), 7.24(d, J=8.3Hz, 2H), 7.32(d, J=8.3Hz, 2H), 7.36(d, J=3.4Hz, 1H), 7.47(d, J=8.3Hz, 2H), 7.65(d, J=8.3Hz, 2H), 12.28(br, 1H)
4-79	DMSO-d ₆ , 300MHz- 120°C	0.73-0.96(m, 5H), 0.98-1.31(m, 5H), 1.34-1.89(m, 13H), 3.20(d, J=7.0Hz, 2H), 4.70(s, 2H), 5.08(s, 2H), 6.93(d, J=3.7Hz, 1H), 7.02(d, J=8.8Hz, 2H), 7.13(d, J=3.7Hz, 1H), 7.22(d, J=8.1Hz, 2H), 7.26-7.37(m, 4H), 7.50(d, J=8.8Hz, 2H), 7.69(d, J=8.4Hz, 2H)
4-80	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.87-1.25(m, 10H), 1.32-1.53(m, 3H), 1.55-1.82(m, 10H), 2.38-2.49(m, 1H), 3.25(d, J=6.8Hz, 2H), 4.71(s, 2H), 5.06(s, 2H), 6.98-7.03(m, 3H), 7.18-7.25(m, 3H), 7.34(d, J=8.3Hz, 2H), 7.50(d, J=8.7Hz, 2H), 7.61(d, J=9.0Hz, 2H), 7.83(d, J=8.7Hz, 2H), 8.70(s, 1H), 12.35(br, 1H)
4-81	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.80(t, J=7.3Hz, 6H), 1.00-1.17(m, 4H), 1.37-1.58(m, 4H), 2.40-2.50(m, 1H), 3.22(s, 2H), 3.97(s, 2H), 5.07(s, 2H), 5.33(s, 1H), 6.90-6.98(m, 3H), 7.07(d, J=8.7Hz, 2H), 7.19-7.27(m, 2H), 7.30-7.39(m, 5H), 7.45-7.56(m, 6H), 7.68(d, J=8.3Hz, 2H), 12.29(br, 1H)
4-82	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79(t, J=7.2Hz, 6H), 1.00-1.27(m, 7H), 1.34-1.61(m, 4H), 1.97(brs, 4H), 3.34(brs, 4H), 4.07-4.19(m, 2H), 4.60(brs, 2H), 4.76(brs, 2H), 5.08(s, 2H), 6.59(d, J=9.0Hz, 2H), 6.92(d, J=8.7Hz, 2H), 7.07(d, J=8.7Hz, 2H), 7.30(brs, 1H), 7.41-7.53(m, 3H), 7.65(d, J=7.5Hz, 2H), 7.76(d, J=7.9Hz, 2H)
4-83	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79(t, J=7.3Hz, 6H), 1.00-1.20(m, 4H), 1.15(t, J=7.2Hz, 3H), 1.38-1.58(m, 4H), 2.40-2.54(m, 1H), 3.44(s, 2H), 3.88(s, 3H), 4.04(q, J=7.2Hz, 2H), 4.02(s, 2H), 4.14(s, 2H), 5.06(s, 2H), 6.92(d, J=8.6Hz, 2H), 7.02(d, J=3.8Hz, 1H), 7.07(d, J=9.0Hz, 2H), 7.17(t, J=7.5Hz, 1H), 7.24(t, J=7.7Hz, 1H), 7.36(d, J=3.8Hz, 1H), 7.46(d, J=8.3Hz, 2H), 7.53(d, J=9.1Hz, 1H), 7.57-7.65(m, 3H)

表 17-75

实施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
4-84	DMSO-d ₆ , 300MHz	1.16-1.45(m, 5H), 1.65-1.83(m, 5H), 2.39-2.49(m, 3H), 2.70(t, J=7.2Hz, 2H), 2.93(t, J=8.1Hz, 2H), 3.31(t, J=8.5Hz, 2H), 3.61(s, 2H), 3.73(s, 2H), 4.27(s, 2H), 6.59(d, J=8.3Hz, 1H), 6.88(d, J=3.8Hz, 1H), 7.06(d, J=3.8Hz, 1H), 7.16-7.40(m, 11H), 12.17(brs, 1H)
4-85	DMSO-d ₆ , 300MHz	1.03(s, 9H), 2.79(s, 2H), 3.24(s, 2H), 3.78(s, 2H), 4.00(s, 2H), 5.54(s, 2H), 7.05-7.18(m, 4H), 7.21-7.45(m, 7H), 7.58-7.64(m, 3H), 7.71(d, J=1.5Hz, 1H), 12.37(brs, 1H)
4-86	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79 (t, J = 7.4 Hz, 6 H), 0.97- 1.17 (m, 4 H), 1.34- 1.59 (m, 4 H), 2.39- 2.55 (m, 1 H), 3.26 (s, 2 H), 3.76 (s, 3 H), 3.96 (s, 2 H), 4.03 (s, 2 H), 5.06 (s, 2 H), 6.93 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 6.99- 7.20 (m, 4 H), 7.26 (s, 1 H), 7.36- 7.51 (m, 4 H), 7.66- 7.80 (m, 4 H), 12.22 (br s, 1 H).
4-87	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79 (t, J = 7.3 Hz, 6 H), 0.98- 1.17 (m, 4 H), 1.36- 1.58 (m, 4 H), 2.38- 2.53 (m, 1 H), 3.41 (s, 2 H), 4.11 (s, 2 H), 4.12 (s, 2 H), 5.06 (s, 2 H), 6.92 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.07 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.43- 7.48 (m, 3 H), 7.54- 7.61 (m, 1 H), 7.66- 7.79 (m, 5 H), 7.94- 8.00 (m, 2 H), 8.37 (d, J = 8.3 Hz, 1 H), 12.54 (br s, 1 H).
4-88	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79 (t, J = 7.2 Hz, 6 H), 0.97- 1.19 (m, 4 H), 1.35- 1.60 (m, 4 H), 2.39- 2.54 (m, 1 H), 3.51 (s, 2 H), 4.18 (s, 2 H), 4.33 (s, 2 H), 5.06 (s, 2 H), 6.93 (d, J = 8.9 Hz, 2 H), 7.07 (d, J = 8.9 Hz, 2 H), 7.37- 7.53 (m, 5 H), 7.70 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 7.82 (d, J = 1.5 Hz, 1 H), 7.90- 7.96 (m, 1 H), 8.07- 8.13 (m, 1 H), 12.58 (br s, 1 H).
4-89	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79 (t, J = 7.1 Hz, 6 H), 0.98- 1.19 (m, 4 H), 1.36- 1.60 (m, 4 H), 2.38- 2.55 (m, 1 H), 3.28 (s, 2 H), 3.84 (s, 2 H), 3.98 (s, 2 H), 5.07 (s, 2 H), 5.29 (s, 2 H), 6.86 (d, J = 1.1 Hz, 1 H), 6.93 (d, J = 8.4 Hz, 2 H), 7.03- 7.31 (m, 8 H), 7.40- 7.43 (m, 1 H), 7.47 (d, J = 8.0 Hz, 2 H), 7.68 (d, J = 8.0 Hz, 2 H), 7.78 (d, J = 1.1 Hz, 1 H), 12.62 (br s, 1 H).

表 17-76

实施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
4-90	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79 (t, J = 7.1 Hz, 6 H), 0.97- 1.17 (m, 4 H), 1.36- 1.59 (m, 4 H), 2.39- 2.53 (m, 1 H), 3.25 (s, 2 H), 3.85 (s, 2 H), 4.05 (s, 2 H), 5.06 (s, 2 H), 6.38- 6.41 (m, 1 H), 6.93 (d, J = 8.8 Hz, 2 H), 7.03- 7.15 (m, 3 H), 7.29- 7.39 (m, 2 H), 7.41- 7.52 (m, 4 H), 7.70 (d, J = 8.1 Hz, 2 H), 7.78 (d, J = 1.1 Hz, 1 H), 11.04 (br s, 1 H), 12.30 (br s, 1 H).
4-91	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79 (t, J = 7.3 Hz, 6 H), 0.99- 1.16 (m, 4 H), 1.36- 1.58 (m, 4 H), 2.38- 2.54 (m, 1 H), 3.31 (s, 2 H), 3.85 (s, 2 H), 4.05 (s, 2 H), 5.07 (s, 2 H), 6.93 (d, J = 8.8 Hz, 2 H), 7.04- 7.12 (m, 3 H), 7.42- 7.55 (m, 5 H), 7.60- 7.75 (m, 5 H), 7.79 (d, J = 1.4 Hz, 1 H), 8.23- 8.26 (m, 1 H), 12.42 (br s, 1 H).
4-92	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79 (t, J = 7.1 Hz, 6 H), 0.98- 1.18 (m, 4 H), 1.36- 1.59 (m, 4 H), 2.39- 2.53 (m, 1 H), 3.38 (s, 2 H), 4.05 (s, 2 H), 4.10 (s, 2 H), 5.07 (s, 2 H), 6.82 (s, 1 H), 6.93 (d, J = 8.6 Hz, 2 H), 7.07 (d, J = 8.6 Hz, 2 H), 7.19- 7.32 (m, 2 H), 7.44- 7.64 (m, 5 H), 7.70 (d, J = 8.4 Hz, 2 H), 7.79 (d, J = 1.4 Hz, 1 H), 12.44 (br s, 1 H).
4-93	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79 (t, J = 7.3 Hz, 6 H), 0.97- 1.17 (m, 4 H), 1.35- 1.59 (m, 4 H), 2.39- 2.53 (m, 1 H), 3.37 (s, 2 H), 4.02 (s, 2 H), 4.07 (s, 2 H), 5.06 (s, 2 H), 6.89- 6.98 (m, 3 H), 7.03- 7.10 (m, 3 H), 7.14 (d, J = 3.7 Hz, 1 H), 7.27 (dd, J = 3.3, 1.1 Hz, 1 H), 7.42- 7.51 (m, 4 H), 7.70 (d, J = 8.1 Hz, 2 H), 7.79 (d, J = 1.1 Hz, 1 H), 12.46 (br s, 1 H).
4-94	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79 (t, J = 7.2 Hz, 6 H), 0.97- 1.17 (m, 4 H), 1.35- 1.59 (m, 4 H), 2.38- 2.54 (m, 1 H), 3.34 (s, 2 H), 3.83 (s, 2 H), 4.01 (s, 2 H), 5.06 (s, 2 H), 6.93 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 6.99- 7.11 (m, 4 H), 7.27- 7.50 (m, 6 H), 7.64 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 7.93 (d, J = 7.9 Hz, 2 H), 12.42 (br s, 1 H).
4-95	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79 (t, J = 7.3 Hz, 6 H), 0.98- 1.18 (m, 4 H), 1.34- 1.59 (m, 4 H), 2.38- 2.54 (m, 1 H), 3.27 (s, 2 H), 3.83 (s, 2 H), 4.03 (s, 2 H), 5.06 (s, 2 H), 6.89- 6.97 (m, 3 H), 7.07 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.26- 7.51 (m, 6 H), 7.58- 7.66 (m, 3 H), 7.79 (d, J = 7.1 Hz, 2 H), 12.66 (br s, 2 H).

表 17-77

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
4-96	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79 (t, J = 7.3 Hz, 6 H), 0.97- 1.17 (m, 4 H), 1.33- 1.60 (m, 4 H), 2.38- 2.53 (m, 1 H), 3.51 (s, 2 H), 4.15 (s, 2 H), 4.21 (s, 2 H), 5.06 (s, 2 H), 6.93 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 6.98- 7.11 (m, 3 H), 7.32- 7.50 (m, 5 H), 7.62 (d, J = 7.9 Hz, 2 H), 7.68- 7.77 (m, 2 H), 12.49 (br s, 1 H).
4-97	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79 (t, J = 7.3 Hz, 6 H), 0.97- 1.18 (m, 4 H), 1.36- 1.61 (m, 4 H), 2.40- 2.54 (m, 1 H), 3.40 (s, 2 H), 4.08 (s, 2 H), 4.16 (s, 2 H), 5.07 (s, 2 H), 6.88- 7.12 (m, 2 H), 7.28- 7.41 (m, 3 H), 7.48 (d, J = 8.3 Hz, 5 H), 7.66 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 7.73- 7.81 (m, 2 H), 7.90- 7.97 (m, 1 H), 12.48 (br s, 1 H).
4-98	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.80 (t, J = 7.3 Hz, 6 H), 0.98- 1.16 (m, 4 H), 1.37- 1.58 (m, 4 H), 2.41- 2.53 (m, 1 H), 3.39 (s, 2 H), 4.05 (s, 2 H), 4.09 (s, 2 H), 5.07 (s, 2 H), 6.93 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.02 (d, J = 3.7 Hz, 1 H), 7.07 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.25- 7.31 (m, 1 H), 7.36- 7.50 (m, 6 H), 7.63- 7.70 (m, 4 H), 7.78 (d, J = 1.4 Hz, 1 H), 12.46 (br s, 1 H).
4-99	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.79 (t, J = 7.3 Hz, 6 H), 1.00- 1.15 (m, 4 H), 1.36- 1.57 (m, 4 H), 2.40- 2.52 (m, 1 H), 4.32 (s, 2 H), 4.96 (s, 2 H), 5.05 (s, 2 H), 6.91 (d, J = 8.6 Hz, 2 H), 7.02- 7.13 (m, 3 H), 7.21 (d, J = 3.7 Hz, 1 H), 7.28- 7.34 (m, 1 H), 7.39- 7.54 (m, 4 H), 7.63 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 7.77- 7.82 (m, 1 H), 12.95 (br s, 1 H).
4-100	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.80 (t, J = 7.3 Hz, 6 H), 0.99- 1.17 (m, 4 H), 1.38- 1.58 (m, 4 H), 2.40- 2.52 (m, 1 H), 3.96 (s, 2 H), 4.68 (s, 2 H), 5.07 (s, 2 H), 6.93 (d, J = 8.8 Hz, 2 H), 7.03- 7.12 (m, 3 H), 7.32 (d, J = 4.0 Hz, 1 H), 7.37 (d, J = 3.7 Hz, 1 H), 7.48 (d, J = 8.5 Hz, 2 H), 7.62 (d, J = 8.5 Hz, 2 H), 7.67 (d, J = 4.0 Hz, 1 H), 12.97 (br s, 1 H).
4-101	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79 (t, J = 7.2 Hz, 6 H), 0.96 (t, J = 7.0 Hz, 3 H), 1.00- 1.17 (m, 4 H), 1.23 (t, J = 7.0 Hz, 3 H), 1.35- 1.61 (m, 4 H), 2.37- 2.55 (m, 1 H), 3.16- 3.50 (m, 6 H), 3.96 (s, 2 H), 4.02 (s, 2 H), 5.07 (s, 2 H), 5.43 (s, 2 H), 6.93 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.00- 7.24 (m, 5 H), 7.31- 7.41 (m, 2 H), 7.48 (d, J = 8.6 Hz, 2 H), 7.58- 7.68 (m, 3 H), 12.08 (br s, 1 H).

表 17-78

実施例	溶媒, Hz	NMR(δ)
4-102	DMSO-d ₆ , 300MHz	1.14-1.48(m, 5H), 1.64-1.85(m, 5H), 2.26(s, 3H), 2.27(s, 3H), 2.38-2.54(m, 1H), 2.87(dd, J=7.7, 14.1Hz, 1H), 3.02(dd, J=7.6, 13.9Hz, 1H), 3.59(t, J=7.5Hz, 1H), 3.81(d, J=14.3Hz, 1H), 3.96(d, J=14.3Hz, 1H), 5.07(s, 2H), 7.05(d, J=1.1Hz, 2H), 7.14-7.35(m, 11H), 7.57(d, J=1.5Hz, 1H), 12.48(brs, 1H)
4-103	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.93(t, J=7.3Hz, 3H), 0.97(t, J=7.0Hz, 3H), 1.36-1.51(m, 2H), 1.65-1.77(m, 2H), 3.26(s, 2H), 3.57(q, J=7.1Hz, 2H), 3.81(s, 2H), 4.00-4.08(m, 4H), 7.07(t, J=8.5Hz, 4H), 7.23-7.44(m, 6H), 7.48(d, J=8.7Hz, 2H), 7.66(d, J=8.4Hz, 2H), 7.80(d, J=1.1Hz, 1H)
4-104	CDCl ₃ - 300MHz	1.17-1.51(m, 5H), 1.67-1.95(m, 5H), 2.30(s, 3H), 2.43-2.57(m, 1H), 2.78(s, 3H), 4.99(s, 2H), 5.19(s, 2H), 6.88(d, J=8.3Hz, 1H), 7.00(dd, J=1.8, 8.4Hz, 1H), 7.14-7.36(m, 7H), 7.53(d, J=1.5Hz, 1H), 7.70(d, J=8.6Hz, 1H), 7.79(d, J=1.9Hz, 1H)
4-105	DMSO-d ₆ , 400MHz	3.27(s, 2H), 3.81(s, 2H), 4.03(s, 2H), 5.17(s, 2H), 7.13-7.18(m, 3H), 7.24-7.29(m, 1H), 7.32-7.40(m, 4H), 7.42-7.49(m, 3H), 7.71(d, J=8.3Hz, 2H), 7.79(d, J=1.6Hz, 1H), 12.40(brs, 1H)
4-106	DMSO-d ₆ , 400MHz	0.79 (t, J = 7.3 Hz, 6 H), 0.99- 1.16 (m, 4 H), 1.38- 1.58 (m, 4 H), 2.40- 2.53 (m, 1 H), 3.35 (s, 2 H), 4.04 (s, 2 H), 4.10 (s, 2 H), 4.94- 5.17 (m, 6 H), 5.92- 6.04 (m, 1 H), 6.92 (d, J = 8.8 Hz, 2 H), 7.02- 7.10 (m, 3 H), 7.16- 7.27 (m, 2 H), 7.37 (d, J = 3.5 Hz, 1 H), 7.44- 7.53 (m, 3 H), 7.59- 7.65 (m, 3 H), 12.60 (br s, 1 H).
4-107	DMSO-d ₆ , 300MHz	0.79 (t, J = 7.2 Hz, 6 H), 0.97- 1.16 (m, 4 H), 1.36- 1.60 (m, 4 H), 2.39- 2.56 (m, 1 H), 4.26 (s, 2 H), 4.90 (s, 2 H), 5.05 (s, 2 H), 6.91 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.06 (d, J = 8.7 Hz, 2 H), 7.19 (d, J = 3.6 Hz, 1 H), 7.34 (s, 1 H), 7.40 (d, J = 3.6 Hz, 1 H), 7.42- 7.49 (m, 4 H), 7.62 (d, J = 8.3 Hz, 2 H), 7.86- 7.92 (m, 2 H), 12.88 (br s, 1 H).

産業上の利用可能性

以上の試験結果等にて示されるように、本発明に係る化合物〔I〕は優れたPTP1B阻害作用及び血糖低下作用を有することが示される。

即ち、本発明に係る化合物〔I〕は、直接的にインスリン作用を改善し、

- 5 高血糖状態を改善することができる新しいタイプの糖尿病の予防又は治療薬として期待される。また、本発明に係る化合物〔I〕は、糖尿病の合併症（網膜症、腎症、神経障害、シンドロームX又はメタボリックシンドローム、虚血性心疾患（心筋梗塞や狭心症等）や脳卒中（脳梗塞、脳出血やくも膜下出血等）等）、高脂血症や肥満症の予防又は治療薬、更に
- 10 にはPTP1Bの介在する疾患の予防又は治療薬としても期待される。

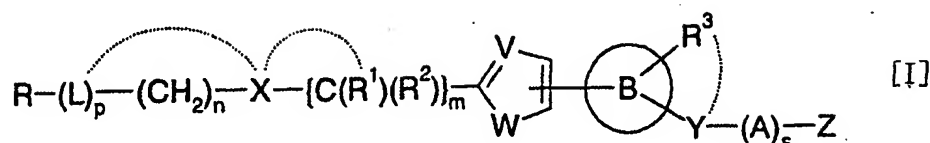
- さらに、本発明に係る化合物〔I〕は、以上の試験結果にて示されるように、インスリン、グリベンクラミド、トルブタミド、ナテグリニド、塩酸メトホルミン、ボグリボース及び塩酸ピオグリタゾンのそれぞれと併用投与することにより血糖低下能を増強する作用が認められることから、インスリン製剤、インスリン分泌促進剤、ビグアナイド剤、 α -グルコシダーゼ阻害剤及びインスリン感受性増強剤を始めとする他の糖尿病治療薬（特に、糖尿病合併症の治療薬以外の相当する治療薬）との併用により、本発明に係る化合物〔I〕及び他の糖尿病治療薬のそれぞれが単独で有する血糖（空腹時、食後）低下能を相互に増強及び／又は補
- 15 完する作用を有することが期待される。また、本発明に係る化合物〔I〕は、他の糖尿病治療薬（特に、糖尿病合併症の治療薬）との併用により、高血糖の改善と糖尿病合併症（特に、細小血管合併症）の予防又は治療を同時に実現できることが期待される。さらには、本発明に係る化合物〔I〕は、他の高脂血症治療薬、肥満症治療薬、高血圧症治療
- 25 薬及び／又は血栓症治療薬との併用により、高血糖、高血中脂質、肥満状態を改善し、ひいては糖尿病合併症（特に、大血管合併症）への移行を防止及び／又はその進展を抑制することが期待される。即ち、本発明に係る化合物〔I〕は、他の糖尿病治療薬、他の高脂血症治療薬、他の肥満症治療薬、高血圧症治療薬又は血栓症治療薬との併用により、各々
- 30 の治療薬単独では発揮し得ない高い糖尿病及び糖尿病合併症の予防又は治療効果を示すことが期待される。

本出願は、日本で出願された特願 2 0 0 3 - 1 0 5 2 6 7 及び特願 2 0 0 3 - 1 5 7 5 9 0 を基礎としており、その内容は本明細書に全て包含されるものである。本明細書で挙げられた特許及び特許出願を含む参考文献は、本明細書で開示された程度まで、その内容は本明細書に全て

5 包含される。

請求の範囲

1. 一般式 [I]



〔式中、

5 Vは=N-又は=CH-を示し；

Wは-S-又は-O-を示し；

mは0、1又は2を示し；

R¹及びR²は、それぞれ独立して、水素原子又はC₁₋₄アルキル基を示し；Xは-N(R⁴)-、-N(R⁵)-CO-O-、-SO₂-N(R⁵)-、10 -N(R⁵)-SO₂-、-N(R⁶)-SO₂-N(R⁵)-、-CO-N(R⁷)-、-N(R⁸)-CO-、-N(R⁹)-CO-N(R⁵)-、-N(R¹⁰)-(CH₂)_k-N(R⁵)-、-N(R¹⁰)-(CH₂)_k-N(R⁵)-CO-、-C(R¹⁰)=N-N(R⁷)-、-N(R¹⁰)-(CH₂)_k-CH(R⁶)-、15 -O-、-S-又は-SO₂-

(式中、

kは0又は1乃至4の整数を示し、

R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R⁹及びR¹⁰は、それぞれ独立して、

(1)水素原子、

20 (2)C₁₋₆アルキル基(当該C₁₋₆アルキル基は

(a)置換されてもよいアリール基、

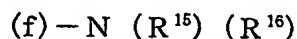
(b)置換されてもよい芳香族ヘテロ環基、

(c)カルボキシ基、

25 (d)C₁₋₄アルコキシカルボニル基、(e)-CO-N(R¹⁵)(R¹⁶)

(式中、R¹⁵及びR¹⁶は、それぞれ独立して、水素原子、置換されてもよいアリール基、置換されてもよい芳香族ヘテロ環基、C₁₋₆アルキル基(当該C₁₋₆アルキル基は置換されてもよいアリール基、置換されてもよい芳香族ヘテロ環基、

- アリール基で置換されてもよい C_{1-4} アルコキシ基及び置換されてもよいアリールオキシ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい)を示すか、又はそれらが結合する窒素原子と一緒に、インドリン環を形成してもよく、若しくはさらに窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択される少なくとも1つのヘテロ原子を含有してもよい5乃至7員ヘテロ環を形成してもよい)、



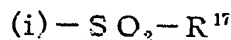
(式中、 R^{15} 及び R^{16} は前記記載の通りである)、



- 10 (式中、 R^{17} は水素原子、置換されてもよいアリール基、置換されてもよい芳香族ヘテロ環基又は C_{1-6} アルキル基(当該 C_{1-6} アルキル基は置換されてもよいアリール基、置換されてもよい芳香族ヘテロ環基、アリール基で置換されてもよい C_{1-4} アルコキシ基及び置換されてもよいアリールオキシ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい)を示す)、

- 15 (h) $-CO-R^{17}$

(式中、 R^{17} は前記記載の通りである)、

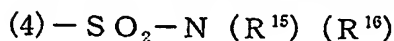


(式中、 R^{17} は前記記載の通りである)又は

(j) C_{3-7} シクロアルキル基で置換されていてもよい)、

- 20 (3) $-CO-N(R^{15})(R^{16})$

(式中、 R^{15} 及び R^{16} は前記記載の通りである)、



(式中、 R^{15} 及び R^{16} は前記記載の通りである)、



- 25 (式中、 R^{17} は前記記載の通りである)、

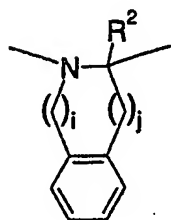


(式中、 R^{17} は前記記載の通りである)、

(7) 置換されてもよいアリール基、

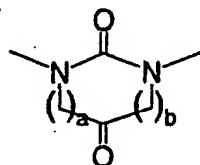
(8) 置換されてもよい芳香族ヘテロ環基を示すか、又は

- 30 (9) R^4 及び R^1 が一緒になって



(式中、 i 及び j は、それぞれ独立して、0、1又は2を示し、 R^2 は前記記載の通りである)を形成してもよく、

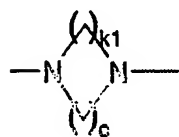
(10) R^5 及び R^9 が一緒になって



5

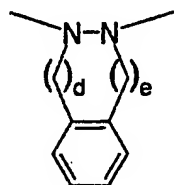
(式中、 a 及び b は、それぞれ独立して、0、1又は2を示す)を形成してもよく、

(11) R^5 及び R^{10} が一緒になって



10 (式中、 $k1$ 及び c は、それぞれ独立して、0又は1乃至4の整数を示す)を形成してもよく、

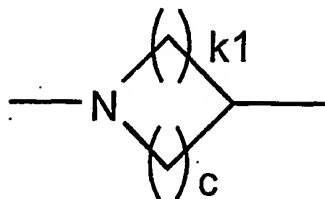
(12) R^6 及び R^{10} が一緒になって



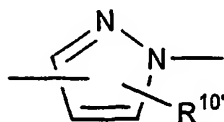
(式中、 d 及び e は、それぞれ独立して、0、1又は2を示す)を形成してもよく、

15

(13) R^6 及び R^{10} が一緒になって



(式中、 $k1$ 及び c は前記記載の通りである) を形成してもよく、若しくは
(14) R^7 及び R^{10} が一緒になって



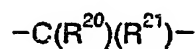
5 (式中、 $R^{10'}$ は水素原子又は C_{1-6} アルキル基を示す) を形成してもよい) を示し；

n は 0 又は 1 乃至 4 の整数を示し；

p は 0 又は 1 を示し；

L は

10 (1)



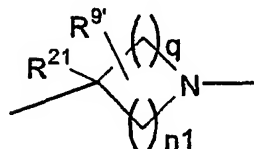
(式中、

R^{20} は

(a) 水素原子、

15 (b) C_{1-6} アルキル基を示すか、又は

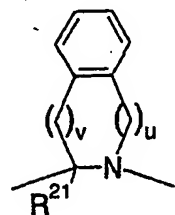
(c) R^4 又は R^8 と一緒になって



(式中、 $n1$ 及び q は、それぞれ独立して、0 又は 1 乃至 4 の整数を示し、 $R^{9'}$ は水素原子、水酸基、 C_{1-6} アルキル基、カルボキシ基又は C_{1-6} アルコキシ

20 基を示す) を形成してもよく、若しくは

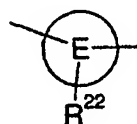
(d) R^4 と一緒になって



(式中、u 及び v は、それぞれ独立して、0、1 又は 2 を示す) を形成してもよく、

- R²¹ は水素原子、C₁₋₆ アルキル基 (当該 C₁₋₆ アルキル基は置換されてもよいアリール基又は置換されてもよい芳香族ヘテロ環基で置換されていてよい)、置換されてもよいアリール基又は置換されてもよい芳香族ヘテロ環基を示す)、

(2)



(式中、

- 10 E はアリール基又は芳香族ヘテロ環基を示し、

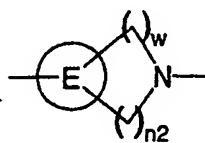
R²² は

- (a) 水素原子、
- (b) ハロゲン原子、
- (c) C₁₋₄ アルキル基、
- 15 (d) カルボキシ基で置換されてもよい C₁₋₄ アルコキシ基、
- (e) C₁₋₆ アルキルチオ基、
- (f) ニトロ基、
- (g) -N (R²³) (R²⁴)

(式中、R²³ 及び R²⁴ は、それぞれ独立して、水素原子、C₁₋₆ アルキル基、C₁₋₄

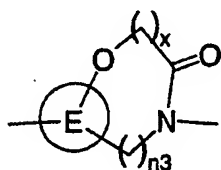
- 20 アルキルカルボニル基 (当該 C₁₋₄ アルキルカルボニル基はアミノ基、C₁₋₄ アルキルアミノ基又はジ (C₁₋₄ アルキル) アミノ基で置換されていてよい) 又は C₁₋₄ アルキルスルホニル基を示す) を示すか、又は

(h) R⁴ と一緒になって



(式中、 n_2 及び w は、それぞれ独立して、0 又は 1 乃至 3 の整数を示し、E は前記記載の通りである) を形成してもよく、

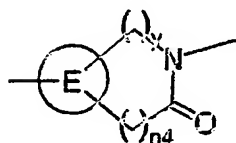
(i) R^4 と一緒になって



5

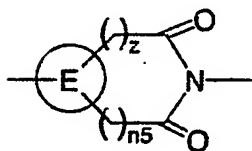
(式中、 n_3 及び x は、それぞれ独立して、0 又は 1 を示し、E は前記記載の通りである) を形成してもよく、

(j) R^7 と一緒になって



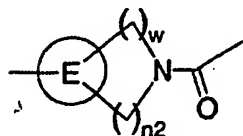
10 (式中、 n_4 及び y は、それぞれ独立して、0、1 又は 2 を示し、E は前記記載の通りである) を形成してもよく、

(k) R^7 と一緒になって



15 (式中、 n_5 及び z は、それぞれ独立して、0 又は 1 を示し、E は前記記載の通りである) を形成してもよく、

(l) R^8 と一緒になって

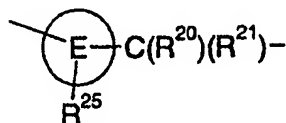


(式中、 n 及び w は、それぞれ独立して、0 又は 1 乃至 3 の整数を示し、 E は前記記載の通りである) を形成してもよく、若しくは

(m) R^4 と一緒になって



- 5 (式中、 E は前記記載の通りである) を形成してもよく、又は、
(3)



(式中、

R^{20} 、 R^{21} 及び E は前記記載の通りであり、

- 10 R^{25} は

- (a) 水素原子、
- (b) ハロゲン原子、
- (c) C_{1-4} アルキル基、
- (d) カルボキシ基で置換されてもよい C_{1-4} アルコキシ基、
- 15 (e) C_{1-6} アルキルチオ基、
- (f) ニトロ基又は
- (g) $-N(R^{23})(R^{24})$

(式中、 R^{23} 及び R^{24} は前記記載の通りである) を示し；

R は $-COO(R^{19})$ 、 $-A^1-COO(R^{19})$ 又は $-O-A^1-COO(R^{19})$

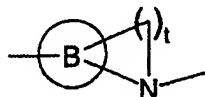
- 20 (式中、 A^1 は C_{1-4} アルキレン基を示し、 R^{19} は水素原子又は C_{1-4} アルキル基を示す) を示し；

B はアリール基又は芳香族ヘテロ環基を示し；

R^3 は

- (1) 水素原子、
- 25 (2) ハロゲン原子、
- (3) C_{1-8} アルキル基、
- (4) C_{1-6} アルコキシ基、

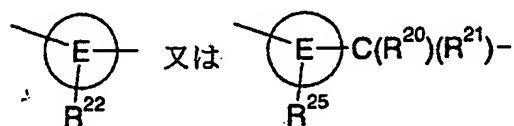
- (5) C_{1-6} アルキルアミノ基、
- (6) ジ (C_{1-6} アルキル) アミノ基、
- (7) シアノ基、
- (8) ニトロ基、
- 5 (9) C_{1-4} ハロアルキル基、
- (10) $-S-R^{18}$ (R^{18} は C_{1-6} アルキル基又はアリール基を示す)、
- (11) $-SO-R^{18}$ (R^{18} は C_{1-6} アルキル基又はアリール基を示す)、
- (12) $-SO_2-R^{18}$ (R^{18} は C_{1-6} アルキル基又はアリール基を示す)、
- (13) アリール基又は
- 10 (14) ヘテロ環基を示し；
- Y は $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-N(R^{11})-$ 、 $-N(R^{12})-C$
 $O-$ 、 $-N(R^{12})-SO_2-$ 、 $-SO_2-N(R^{12})-$ 、 $-C(R^{13})(R^{14})-$ 、
 $-CO-$ 、 $-C(R^{13})(R^{14})-N(R^{12})-$ 、 $-CO-N(R^{12})-$ 又は $-C$
 $(R^{13})(R^{14})-O-$
- 15 (式中、
- R^{11} は
- (1) 水素原子、
- (2) C_{1-8} アルキル基
- (当該 C_{1-8} アルキル基は
- 20 (a) C_{3-7} シクロアルキル基、
- (b) 置換されてもよいアリール基、
- (c) 置換されてもよいヘテロ環基、
- (d) 水酸基、
- (e) C_{1-4} アルキルアミノ基及び
- 25 (f) ジ (C_{1-4} アルキル) アミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい)、
- (3) C_{2-4} アルケニル基、
- (4) C_{1-4} アルキルスルホニル基、
- (5) C_{1-4} アルキルカルボニル基
- 30 (当該 C_{1-4} アルキルカルボニル基は水酸基又は C_{1-4} アルコキシ基で置換されていてもよい) を示すか、又は
- (6) R^3 と一緒になって



(式中、 t は1乃至4の整数を示し、 B は前記記載の通りである)を形成してもよく、

R^{12} は

- 5 (1)水素原子、
- (2) C_{1-8} アルキル基
(当該 C_{1-8} アルキル基は
 - (a) C_{3-7} シクロアルキル基、
 - (b)置換されてもよいアリール基、
 - 10 (c)置換されてもよいヘテロ環基、
 - (d)水酸基、
 - (e) C_{1-4} アルキルアミノ基及び
 - (f)ジ (C_{1-4} アルキル) アミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい)、
- 15 (3) C_{2-4} アルケニル基、
- (4) C_{1-4} アルキルスルホニル基又は
- (5) C_{1-4} アルキルカルボニル基
(当該 C_{1-4} アルキルカルボニル基は水酸基又は C_{1-4} アルコキシ基で置換されていてもよい)を示し、
- 20 R^{13} 及び R^{14} は、それぞれ独立して、水素原子、 C_{1-4} アルキル基を示すか、又はそれらが結合する炭素原子と一緒になって C_{3-7} シクロアルカンを形成してもよく、若しくはそれらが結合する炭素原子と一緒になって、さらに窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択される少なくとも1つのヘテロ原子を含有してもよい5乃至7員ヘテロ環を形成してもよい)を示し
- 25 (但し、
 m が0であり、 p が1であり、 L が



(式中、 R^{20} 及び R^{21} はそれぞれ水素原子を示し、 E はフェニル基を示し、 R^{22} は水素原子、ハロゲン原子、 C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基又はニトロ基を示し、 R^{25} は水素原子、ハロゲン原子、 C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基又はニトロ基を示す)である場合には、

5 Yは、

$-C(R^{13})(R^{14})-N(R^{12})-$ 、 $-CO-N(R^{12})-$ 又は $-C(R^{13})(R^{14})-O-$ (式中、 R^{12} 、 R^{13} 及び R^{14} は前記記載の通りである)である)；

sは0又は1を示し；

Aは C_{3-7} シクロアルキル基で置換されてもよい C_{1-4} アルキレン基を示し；

10 Zは

(1) C_{3-7} シクロアルキル基

(当該 C_{3-7} シクロアルキル基はアリール基(当該アリール基はハロゲン原子又は C_{1-6} アルキル基で置換されてもよい)又は芳香族ヘテロ環基(当該芳香族ヘテロ環基はハロゲン原子又は C_{1-6} アルキル基で置換されてもよい)で置換されていてもよい)、

15

(2) アリール基

(当該アリール基は

(a) C_{1-4} アルキル基又は C_{1-4} アルキルカルボニル基で置換されてもよいヘテロ環基、

20

(b) 水酸基、オキソ基、ハロゲン原子又は C_{1-6} アルキル基で置換されてもよい C_{3-7} シクロアルキル基、

(c) カルボキシ基、

(d) ハロゲン原子、

(e) C_{1-8} アルキル基、

25

(f) C_{1-4} ハロアルキル基、

(g) C_{1-4} アルキルアミノ基、

(h) ジ(C_{1-4} アルキル)アミノ基、

(i) C_{1-6} アルキルチオ基、

(j) C_{1-4} アルコキシ基

30

(k) C_{1-4} アルキルカルボニル基及び

(l) ニトロ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい)、

(3) 芳香族ヘテロ環基

(当該芳香族ヘテロ環基は

(a) C_{1-4} アルキル基又は C_{1-4} アルキルカルボニル基で置換されてもよいヘテロ環基、

(b) 水酸基、オキシ基、ハロゲン原子又は C_{1-6} アルキル基で置換されてもよい

5 C_{3-7} シクロアルキル基、

(c) カルボキシ基、

(d) ハロゲン原子、

(e) C_{1-8} アルキル基、

(f) C_{1-4} ハロアルキル基、

10 (g) C_{1-4} アルキルアミノ基、

(h) ジ (C_{1-4} アルキル) アミノ基、

(i) C_{1-6} アルキルチオ基、

(j) C_{1-4} アルコキシ基、

(k) C_{1-4} アルキルカルボニル基及び

15 (l) ハロゲン原子又は C_{1-4} ハロアルキル基で置換されてもよいアリール基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい)、

(4) インダニル基又は

(5) ピペラジニル基

(当該ピペラジニル基は

20 (a) フェニル基、

(b) フェニル C_{1-4} アルキル基、

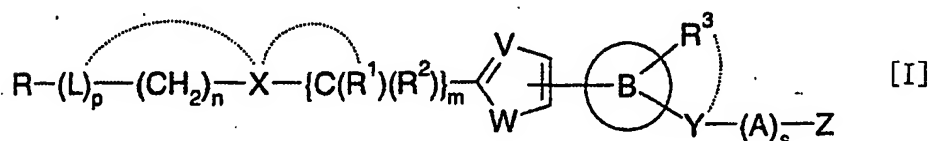
(c) ハロゲン原子で置換されてもよいベンゾイル基及び

(d) フェニル C_{1-4} アルコキシカルボニル基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい) を示す] で示される複素芳香 5 員環化合物若しくはその

25 プロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩。

2. 一般式 [I]

一般式 [I]



[式中、

Vは=N-又は=CH-を示し；

Wは-S-又は-O-を示し；

mは0、1又は2を示し；

R¹及びR²は、それぞれ独立して、水素原子又はC₁₋₄アルキル基を示し；

- 5 Xは-N(R⁴)-、-N(R⁵)-CO-O-、-SO₂-N(R⁵)-、-N(R⁵)-SO₂-、-N(R⁶)-SO₂-N(R⁵)-、-CO-N(R⁷)-、-N(R⁸)-CO-、-N(R⁹)-CO-N(R⁵)-、-N(R¹⁰)-(CH₂)_k-N(R⁵)-、-O-、-S-又は-SO₂-

(式中、

- 10 kは0又は1乃至4の整数を示し、

R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R⁹及びR¹⁰は、それぞれ独立して、

(1)水素原子、

(2)C₁₋₆アルキル基

(当該C₁₋₆アルキル基は

- 15 (a)置換されてもよいアリール基、
(b)置換されてもよい芳香族ヘテロ環基、
(c)カルボキシ基、
(d)C₁₋₄アルコキシカルボニル基、
(e)-CO-N(R¹⁵)(R¹⁶)

- 20 (式中、R¹⁵及びR¹⁶は、それぞれ独立して、水素原子、置換されてもよいアリール基、置換されてもよい芳香族ヘテロ環基、C₁₋₆アルキル基(当該C₁₋₆アルキル基は置換されてもよいアリール基、置換されてもよい芳香族ヘテロ環基、アリール基で置換されてもよいC₁₋₄アルコキシ基及び置換されてもよいアリールオキシ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい)を示すか、
25 又はそれらが結合する窒素原子と一緒にあって、インドリン環を形成してもよく、若しくはさらに窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択される少なくとも1つのヘテロ原子を含有してもよい5乃至7員ヘテロ環を形成してもよい)、

(f)-N(R¹⁵)(R¹⁶)

- 30 (式中、R¹⁵及びR¹⁶は前記記載の通りである)、

(g)-O-R¹⁷

(式中、R¹⁷は水素原子、置換されてもよいアリール基、置換されてもよい芳香

族ヘテロ環基又は C_{1-6} アルキル基（当該 C_{1-6} アルキル基は置換されてもよいアリール基、置換されてもよい芳香族ヘテロ環基、アリール基で置換されてもよい C_{1-4} アルコキシ基及び置換されてもよいアリールオキシ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい）を示す）、

5 (h) $-CO-R^{17}$

（式中、 R^{17} は前記記載の通りである）、

(i) $-SO_2-R^{17}$

（式中、 R^{17} は前記記載の通りである）又は

(j) C_{3-7} シクロアルキル基で置換されていてもよい）、

10 (3) $-CO-N(R^{15})(R^{16})$

（式中、 R^{15} 及び R^{16} は前記記載の通りである）、

(4) $-SO_2-N(R^{15})(R^{16})$

（式中、 R^{15} 及び R^{16} は前記記載の通りである）、

(5) $-CO-R^{17}$

15 （式中、 R^{17} は前記記載の通りである）、

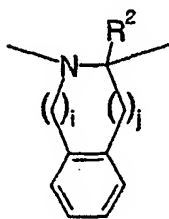
(6) $-SO_2-R^{17}$

（式中、 R^{17} は前記記載の通りである）、

(7) 置換されてもよいアリール基、

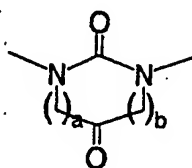
(8) 置換されてもよい芳香族ヘテロ環基を示すか、又は

20 (9) R^4 及び R^1 が一緒になって



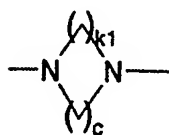
（式中、 i 及び j は、それぞれ独立して、0、1又は2を示し、 R^2 は前記記載の通りである）を形成してもよく、

(10) R^5 及び R^9 が一緒になって



(式中、a 及び b は、それぞれ独立して、0、1 又は 2 を示す) を形成してもよく、

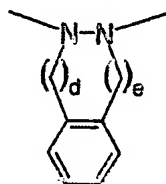
(11) R^5 及び R^{10} が一緒になって



5

(式中、k1 及び c は、それぞれ独立して、0 又は 1 乃至 4 の整数を示す) を形成してもよく、若しくは

(12) R^5 及び R^{10} が一緒になって



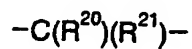
10 (式中、d 及び e は、それぞれ独立して、0、1 又は 2 を示す) を形成してもよい) を示し；

n は 0 又は 1 乃至 4 の整数を示し；

p は 0 又は 1 を示し；

L は

15 (1)



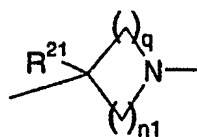
(式中、

R^{20} は

(a) 水素原子、

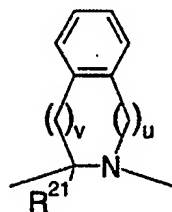
20 (b) C_{1-6} アルキル基を示すか、又は

(c) R^4 と一緒になって



(式中、 $n1$ 及び q は、それぞれ独立して、0 又は 1 乃至 4 の整数を示す) を形成してもよく、若しくは

5 (d) R^4 と一緒になって

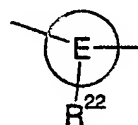


(式中、 u 及び v は、それぞれ独立して、0、1 又は 2 を示す) を形成してもよく、

R^{21} は水素原子、 C_{1-6} アルキル基 (当該 C_{1-6} アルキル基は置換されてもよいア

10 リール基又は置換されてもよい芳香族ヘテロ環基で置換されていてもよい)、置換されてもよいアリール基又は置換されてもよい芳香族ヘテロ環基を示す)、

(2)



(式中、

15 E はアリール基又は芳香族ヘテロ環基を示し、

R^{22} は

(a) 水素原子、

(b) ハロゲン原子、

(c) C_{1-4} アルキル基、

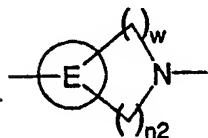
20 (d) カルボキシ基で置換されてもよい C_{1-4} アルコキシ基、

(e) C_{1-6} アルキルチオ基、

(f) ニトロ基、

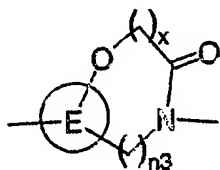
(g) $-N(R^{23})(R^{24})$

- (式中、 R^{23} 及び R^{24} は、それぞれ独立して、水素原子、 C_{1-6} アルキル基、 C_{1-4} アルキルカルボニル基（当該 C_{1-4} アルキルカルボニル基はアミノ基、 C_{1-4} アルキルアミノ基又はジ（ C_{1-4} アルキル）アミノ基で置換されていてもよい）又は C_{1-4} アルキルスルホニル基を示す）を示すか、又は
- 5 (h) R^4 と一緒になって



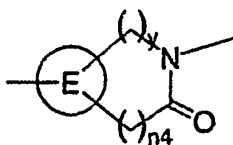
(式中、 n_2 及び w は、それぞれ独立して、0 又は 1 乃至 3 の整数を示し、 E は前記記載の通りである) を形成してもよく、

- 10 (i) R^4 と一緒になって



(式中、 n_3 及び x は、それぞれ独立して、0 又は 1 を示し、 E は前記記載の通りである) を形成してもよく、

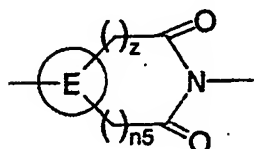
(j) R^7 と一緒になって



15

(式中、 n_4 及び y は、それぞれ独立して、0、1 又は 2 を示し、 E は前記記載の通りである) を形成してもよく、

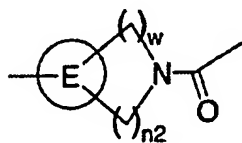
(k) R^7 と一緒になって



- 20 (式中、 n_5 及び z は、それぞれ独立して、0 又は 1 を示し、 E は前記記載の通

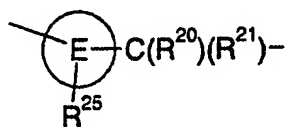
りである)を形成してもよく、若しくは

(1) R^8 と一緒にあって



(式中、 n_2 及び w は、それぞれ独立して、0 又は 1 乃至 3 の整数を示し、 E は
5 前記記載の通りである)を形成してもよい) 又は

(3)



(式中、

R^{20} 、 R^{21} 及び E は前記記載の通りであり、

10 R^{25} は

(a) 水素原子、

(b) ハロゲン原子、

(c) C_{1-4} アルキル基、

(d) カルボキシ基で置換されてもよい C_{1-4} アルコキシ基、

15 (e) C_{1-6} アルキルチオ基、

(f) ニトロ基又は

(g) $-N(R^{23})(R^{24})$

(式中、 R^{23} 及び R^{24} は前記記載の通りである)を示し；

R は $-COO(R^{19})$ 、 $-A^1-COO(R^{19})$ 又は $-O-A^1-COO(R^{19})$

20 (式中、 A^1 は C_{1-4} アルキレン基を示し、 R^{19} は水素原子又は C_{1-4} アルキル基を示す)を示し；

B はアリール基又は芳香族ヘテロ環基を示し；

R^3 は

(1) 水素原子、

25 (2) ハロゲン原子、

(3) C_{1-8} アルキル基、

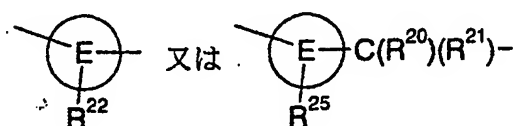
- (4) C_{1-6} アルコキシ基、
- (5) C_{1-6} アルキルアミノ基、
- (6) ジ (C_{1-6} アルキル) アミノ基、
- (7) シアノ基、
- 5 (8) ニトロ基、
- (9) C_{1-4} ハロアルキル基、
- (10) $-S-R^{18}$ (R^{18} は C_{1-6} アルキル基又はアリール基を示す)、
- (11) $-SO-R^{18}$ (R^{18} は C_{1-6} アルキル基又はアリール基を示す) 又は
- (12) $-SO_2-R^{18}$ (R^{18} は C_{1-6} アルキル基又はアリール基を示す) を示し；
- 10 Y は $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-N(R^{11})-$ 、 $-N(R^{12})-C$
 $O-$ 、 $-N(R^{12})-SO_2-$ 、 $-SO_2-N(R^{12})-$ 、 $-C(R^{13})(R^{14})-$ 、
 $-CO-$ 、 $-C(R^{13})(R^{14})-N(R^{12})-$ 、 $-CO-N(R^{12})-$ 又は $-C$
 $(R^{13})(R^{14})-O-$
 (式中、
- 15 R^{11} は
- (1) 水素原子、
- (2) C_{1-8} アルキル基
 (当該 C_{1-8} アルキル基は
- (a) C_{3-7} シクロアルキル基、
- 20 (b) 置換されてもよいアリール基、
- (c) 置換されてもよいヘテロ環基、
- (d) 水酸基、
- (e) C_{1-4} アルキルアミノ基及び
- (f) ジ (C_{1-4} アルキル) アミノ基からなる群より選択される置換基で置換され
- 25 ていてもよい)、
- (3) C_{2-4} アルケニル基、
- (4) C_{1-4} アルキルスルホニル基、
- (5) C_{1-4} アルキルカルボニル基
 (当該 C_{1-4} アルキルカルボニル基は水酸基又は C_{1-4} アルコキシ基で置換されて
- 30 いてもよい) を示すか、又は
- (6) R^3 と一緒になって



(式中、 t は 1 乃至 4 の整数を示し、 B は前記記載の通りである) を形成してもよく、

R^{12} は

- 5 (1) 水素原子、
- (2) C_{1-8} アルキル基
(当該 C_{1-8} アルキル基は
 - (a) C_{3-7} シクロアルキル基、
 - (b) 置換されてもよいアリール基、
 - 10 (c) 置換されてもよいヘテロ環基、
 - (d) 水酸基、
 - (e) C_{1-4} アルキルアミノ基及び
 - (f) ジ (C_{1-4} アルキル) アミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい)、
- 15 (3) C_{2-4} アルケニル基、
- (4) C_{1-4} アルキルスルホニル基又は
- (5) C_{1-4} アルキルカルボニル基
(当該 C_{1-4} アルキルカルボニル基は水酸基又は C_{1-4} アルコキシ基で置換されていてもよい) を示し、
- 20 R^{13} 及び R^{14} は、それぞれ独立して、水素原子、 C_{1-4} アルキル基を示すか、又はそれらが結合する炭素原子と一緒になって C_{3-7} シクロアルカンを形成してもよく、若しくはそれらが結合する炭素原子と一緒になって、さらに窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択される少なくとも 1 つのヘテロ原子を含有してもよい 5 乃至 7 員ヘテロ環を形成してもよい) を示し
- 25 (但し、
 m が 0 であり、 p が 1 であり、 L が



(式中、 R^{20} 及び R^{21} はそれぞれ水素原子を示し、 E はフェニル基を示し、 R^{22} は水素原子、ハロゲン原子、 C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基又はニトロ基を示し、 R^{25} は水素原子、ハロゲン原子、 C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基又はニトロ基を示す) である場合には、

5 Yは、

—C (R^{13}) (R^{14}) —N (R^{12}) —、—CO—N (R^{12}) —又は—C (R^{13}) (R^{14}) —O— (式中、 R^{12} 、 R^{13} 及び R^{14} は前記記載の通りである) である)；

s は0又は1を示し；

Aは C_{3-7} シクロアルキル基で置換されてもよい C_{1-4} アルキレン基を示し；

10 Zは

(1) C_{3-7} シクロアルキル基

(当該 C_{3-7} シクロアルキル基はアリール基 (当該アリール基はハロゲン原子又は C_{1-6} アルキル基で置換されてもよい) 又は芳香族ヘテロ環基 (当該芳香族ヘテロ環基はハロゲン原子又は C_{1-6} アルキル基で置換されてもよい) で置換されていてもよい)、

15

(2) アリール基

(当該アリール基は

(a) C_{1-4} アルキル基又は C_{1-4} アルキルカルボニル基で置換されてもよいヘテロ環基、

20 (b) 水酸基、オキシ基、ハロゲン原子又は C_{1-6} アルキル基で置換されてもよい C_{3-7} シクロアルキル基、

(c) カルボキシ基、

(d) ハロゲン原子、

(e) C_{1-8} アルキル基、

25 (f) C_{1-4} ハロアルキル基、

(g) C_{1-4} アルキルアミノ基、

(h) ジ (C_{1-4} アルキル) アミノ基、

(i) C_{1-6} アルキルチオ基、

(j) C_{1-4} アルコキシ基及び

30 (k) C_{1-4} アルキルカルボニル基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい)、

(3) 芳香族ヘテロ環基

(当該芳香族ヘテロ環基は

(a) C_{1-4} アルキル基又は C_{1-4} アルキルカルボニル基で置換されてもよいヘテロ環基、

(b) 水酸基、オキシ基、ハロゲン原子又は C_{1-6} アルキル基で置換されてもよい

5 C_{3-7} シクロアルキル基、

(c) カルボキシ基、

(d) ハロゲン原子、

(e) C_{1-8} アルキル基、

(f) C_{1-4} ハロアルキル基、

10 (g) C_{1-4} アルキルアミノ基、

(h) ジ (C_{1-4} アルキル) アミノ基、

(i) C_{1-6} アルキルチオ基、

(j) C_{1-4} アルコキシ基、

(k) C_{1-4} アルキルカルボニル基及び

15 (l) ハロゲン原子又は C_{1-4} ハロアルキル基で置換されてもよいアリール基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい)、

(4) インダニル基又は

(5) ピペラジニル基

(当該ピペラジニル基は

20 (a) フェニル基、

(b) フェニル C_{1-4} アルキル基、

(c) ハロゲン原子で置換されてもよいベンゾイル基及び

(d) フェニル C_{1-4} アルコキシカルボニル基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい) を示す] で示される請求項 1 記載の複素芳香 5 員環化合

25 物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩。

3. 一般式 [I] において、

R^3 は

(1) 水素原子、

(2) ハロゲン原子、

30 (3) C_{1-6} アルキル基又は

(4) C_{1-4} アルコキシ基を示し；

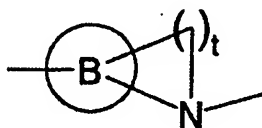
Y は $-O-$ 、 $-N(R^{11})-$ 、 $-N(R^{12})-CO-$ 、 $-C(R^{13})(R^{14})-$ 、 $-$

$C(R^{13})(R^{14})-N(R^{12})-$ 、 $-CO-N(R^{12})-$ 又は $-C(R^{13})(R^{14})-O-$

(式中、

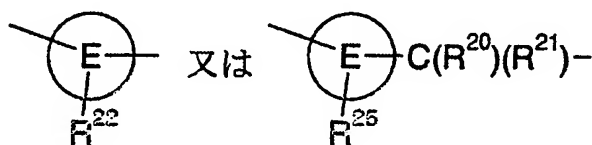
R^{11} は

- 5 (1)水素原子、
 (2) C_{1-8} アルキル基を示すか、又は
 (3) R^3 と一緒になって



(式中、 t は3を示し、 B は請求項2に記載の通りである)を形成してもよく、

- 10 R^{12} は水素原子又は C_{1-3} アルキル基を示し、
 R^{13} 及び R^{14} はそれぞれ水素原子を示す)を示し
 (但し、
 m が0であり、 p が1であり、 L が



- 15 (式中、 R^{20} 及び R^{21} はそれぞれ水素原子を示し、 E はフェニル基を示し、 R^{22} は水素原子、 C_{1-4} アルコキシ基又はニトロ基を示し、 R^{25} は水素原子、 C_{1-4} アルコキシ基又はニトロ基を示す)である場合には、
 Y は、
 $-C(R^{13})(R^{14})-N(R^{12})-$ 、 $-CO-N(R^{12})-$ 又は $-C(R^{13})(R^{14})-O-$ (式中、 R^{12} 、 R^{13} 及び R^{14} は前記記載の通りである)を示す)；
 s は0又は1を示し；
 A は C_{1-4} アルキレン基を示し；
 Z は
 (a)ハロゲン原子及び C_{1-6} アルキル基からなる群より選択される1乃至3の置換基で置換されてもよい C_{3-7} シクロアルキル基、
 25

- (b) ハロゲン原子、
- (c) C_{1-8} アルキル基、
- (d) C_{1-4} ハロアルキル基、
- (e) ジ (C_{1-4} アルキル) アミノ基、
- 5 (f) C_{1-6} アルキルチオ基及び
- (g) C_{1-4} アルキルカルボニル基

からなる群より選択される置換基で置換されたアリール基を示す請求項 1 記載の複素芳香 5 員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩。

- 10 4. V が $=N-$ であり且つ W が $-S-$ 若しくは $-O-$ であるか、又は V が $=CH-$ であり且つ W が $-S-$ である請求項 3 記載の複素芳香 5 員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩。

5. Z が C_{1-8} アルキル基で置換されたフェニル基である請求項 4 記載の複素芳香 5 員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩。

- 15 6. Y が $-C(R^{13})(R^{14})-N(R^{12})-$ 若しくは $-C(R^{13})(R^{14})-O-$ (式中、 R^{12} 、 R^{13} 及び R^{14} は請求項 3 に記載の通りである) であり且つ s が 0 であるか、又は Y が $-O-$ 若しくは $-N(R^{11})-$ (式中、 R^{11} は請求項 3 に記載の通りである) であり且つ s が 1 であり、A がメチレン基である請求項 5 記載の複素芳香 5 員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩。
- 20

7. V が $=CH-$ であり、W が $-S-$ であり、且つ前記の V 及び W が構成するチオフェン環上における B の置換位置が 4 位又は 5 位である請求項 6 記載の複素芳香 5 員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩。

8. B がフェニル基である請求項 7 記載の複素芳香 5 員環化合物若しくはそのプロ

- 25 ロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩。

9. m が 1 であり；

R^1 及び R^2 がそれぞれ水素原子であり；

X が $-N(R^4)-$ 又は $-O-$

(式中、 R^4 は

- 30 (a) アリール基、
- (b) 1 乃至 3 個の C_{1-8} アルキル基で置換されてもよい芳香族ヘテロ環基又は
- (c) $-CO-N(R^{15})(R^{16})$

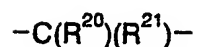
(式中、 R^{15} 及び R^{16} は、それぞれ独立して、水素原子又はアリール基 (当該アリール基は 1 乃至 3 個の C_{1-8} アルキル基で置換されていてもよい) を示す) で置換されていてもよい C_{1-6} アルキル基を示す) であり ;

n が 0 又は 1 であり ;

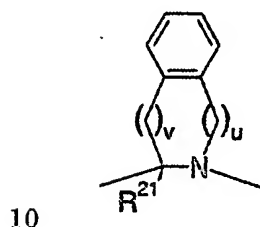
5 p が 0 又は 1 であり ;

L が

(1)



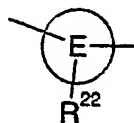
(式中、 R^{20} は R^4 と一緒になって



(式中、 u は 1 を示し、 v は 1 を示す) を形成し、

R^{21} は水素原子を示す) 又は

(2)



15 (式中、 E は芳香族ヘテロ環基を示し、 R^{22} は水素原子を示す) であり ;

R が $-COO(R^{19})$

(式中、 R^{19} は水素原子を示す) である請求項 8 記載の複素芳香 5 員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩。

10. X が $-N(R^4)$ (式中、 R^4 は請求項 9 に記載の通りである) であり、 n
20 が 1 であり、 p が 0 である請求項 9 記載の複素芳香 5 員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩。

11. R^4 が 1 個の C_{1-8} アルキル基で置換されてもよい芳香族ヘテロ環基で置換されたメチル基である請求項 10 記載の複素芳香 5 員環化合物若しくはそのプロ

ドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩。

12. 請求項11記載の芳香族ヘテロ環がチアゾリル基、オキサゾリル基又はベンズイミダゾリル基である請求項11記載の複素芳香5員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩。

5 13. R^4 が $-\text{CO}-\text{N}(R^{15})(R^{16})$ (式中、 R^{15} は水素原子を示し、 R^{16} は1個の C_{1-8} アルキル基で置換されてもよいアリール基を示す) で置換されたメチル基である請求項10記載の複素芳香5員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩。

14. Vが $=\text{N}-$ であり、Wが $-\text{S}-$ であり、且つ前記のV及びWが構成するチアゾール環上におけるBの置換位置が4位である請求項6記載の複素芳香5員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩。

15. Bがフェニル基である請求項14記載の複素芳香5員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩。

16. mが0又は1であり；

15 R^1 及び R^2 が、それぞれ独立して、水素原子又は C_{1-4} アルキル基であり；
Xが $-\text{N}(R^4)-$ 、 $-\text{N}(R^5)-\text{CO}-\text{O}-$ 、 $-\text{SO}_2-\text{N}(R^5)-$ 、 $-\text{CO}-\text{N}(R^7)-$ 、 $-\text{N}(R^9)-\text{CO}-\text{N}(R^5)-$ 、 $-\text{N}(R^{10})-(\text{CH}_2)_k-\text{N}(R^5)-$ 、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{S}-$ 又は $-\text{SO}_2-$

(式中、

20 R^4 は

(1) 水素原子、

(2) C_{1-6} アルキル基

(当該 C_{1-6} アルキル基は

(a) ハロゲン原子、 C_{1-3} アルキル基及び C_{1-4} ハロアルキル基からなる群より選択される1乃至3個の置換基で置換されてもよいアリール基、

(b) 1乃至3個の C_{1-8} アルキル基で置換されてもよい芳香族ヘテロ環基、

(c) カルボキシ基、

(d) C_{1-4} アルコキシカルボニル基、

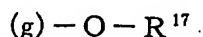
(e) $-\text{CO}-\text{N}(R^{15})(R^{16})$

30 (式中、 R^{15} 及び R^{16} は、それぞれ独立して、水素原子、アリール基 (当該アリール基は C_{1-8} アルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、カルボキシ基及びジ (C_{1-4} アルキル) アミノ基からなる群より選択される1乃至3個の置換基で置換されてい

てもよい)、芳香族ヘテロ環基、 C_{1-6} アルキル基 (当該 C_{1-6} アルキル基はアリール基で置換されていてもよい) を示すか、又はそれらが結合する窒素原子と一緒に、さらに窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択される少なくとも1つのヘテロ原子を含有してもよい5乃至7員ヘテロ環を形成してもよい)、



(式中、 R^{15} 及び R^{16} は、それぞれ独立して、水素原子又はアリール基を示す)、



(式中、 R^{17} はアリール基を示す) 又は

10 (h) C_{3-7} シクロアルキル基で置換されていてもよい)、



(式中、 R^{15} 及び R^{16} は、それぞれ独立して、水素原子、アリール基 (当該アリール基は1乃至3個の C_{1-8} アルキル基で置換されていてもよい)、 C_{1-6} アルキル基を示すか、又はそれらが結合する窒素原子と一緒に、インドリン環を
15 形成してもよく、若しくはさらに窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択される少なくとも1つのヘテロ原子を含有してもよい5乃至7員ヘテロ環を形成してもよい)、



(式中、 R^{15} 及び R^{16} は、それぞれ独立して、アリール基又は C_{1-6} アルキル基を
20 示す)、



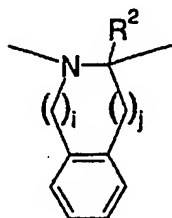
(式中、 R^{17} はアリール基 (当該アリール基は C_{1-8} アルキル基及び C_{1-4} アルコキシ基からなる群より選択される1乃至3個の置換基で置換されていてもよい)、芳香族ヘテロ環基又は C_{1-6} アルキル基 (当該 C_{1-6} アルキル基は、ハロゲン原子
25 及び C_{1-8} アルキル基から選択される1乃至3個の置換基で置換されてもよいアリール基、芳香族ヘテロ環基、アリール基で置換されてもよい C_{1-4} アルコキシ基又は1乃至3個の C_{1-8} アルキル基で置換されてもよいアリールオキシ基で置換されていてもよい) を示す)、



30 (式中、 R^{17} はアリール基を示す)、

(7) アリール基を示すか、又は

(8) R^1 と一緒になって



(式中、 i 及び j はそれぞれ 1 を示し、 R^2 は前記記載の通りである) を形成してもよく、

R^5 は水素原子又はアリール基若しくは C_{3-7} シクロアルキル基で置換されていて

5 もよい C_{1-6} アルキル基を示し、

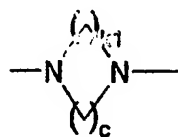
R^7 は水素原子又は C_{1-6} アルキル基を示し、

R^9 は水素原子又は C_{1-6} アルキル基を示し、

k は 2 を示し、

R^{10} は

- 10 (1) 水素原子、
 (2) C_{1-6} アルキル基を示すか、又は
 (3) R^5 と一緒になって



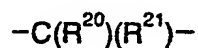
(式中、 $k1$ 及び c はそれぞれ 2 を示す) を形成してもよい) であり；

15 n が 0 又は 1 乃至 3 の整数であり；

p が 0 又は 1 であり；

L が

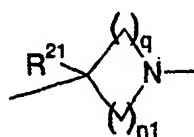
(1)



20 (式中、

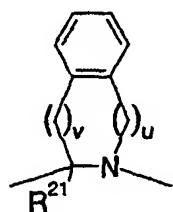
R^{20} は

- (a) 水素原子、
 (b) C_{1-6} アルキル基を示すか、又は
 (c) R^4 と一緒になって



(式中、 n_1 及び q は、それぞれ独立して、1 乃至 3 の整数を示す) を形成してもよく、若しくは

(d) R^4 と一緒になって

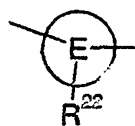


5

(式中、 u は 1 を示し、 v は 1 を示す) を形成してもよく、

R^{21} は水素原子、 C_{1-6} アルキル基 (当該 C_{1-6} アルキル基は 1 乃至 3 個のハロゲン原子で置換されてもよいアリール基で置換されていてもよい) 又はアリール基を示す) 又は

10 (2)



(式中、

E はアリール基又は芳香族ヘテロ環基を示し、

R^{22} は

15 (a) 水素原子、

(b) カルボキシ基で置換されてもよい C_{1-4} アルコキシ基、

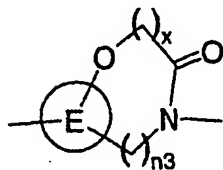
(c) ニトロ基、

(d) $-N(R^{23})(R^{24})$

(式中、 R^{23} 及び R^{24} は、それぞれ独立して、水素原子、 C_{1-4} アルキルカルボニル基 (当該 C_{1-4} アルキルカルボニル基は C_{1-4} アルキルアミノ基又はジ (C_{1-4} アルキル) アミノ基で置換されていてもよい) 又は C_{1-4} アルキルスルホニル基を示す) を示すか、又は

20

(e) R^4 と一緒にあって



(式中、 n_3 は0を示し、 x は1を示し、 E は前記記載の通りである)を形成してもよい)であり；

5 Rが $-COO(R^{19})$

(式中、 R^{19} は水素原子又は C_{1-4} アルキル基を示す)である請求項15記載の複素芳香5員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩。

10 17. m が1であり、 R^1 及び R^2 がそれぞれ水素原子である請求項16記載の複素芳香5員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩。

18. X が $-N(R^4)$ (式中、 R^4 は請求項16に記載の通りである)であり、 n が1であり、 p が0である請求項17記載の複素芳香5員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩。

15 19. R^4 が

(a)ハロゲン原子、 C_{1-8} アルキル基及び C_{1-4} ハロアルキル基からなる群より選択される1乃至3個の置換基で置換されてもよいアリール基、

(b)1乃至3個の C_{1-6} アルキル基で置換されてもよい芳香族ヘテロ環基、

(c)カルボキシ基、

20 (d) C_{1-4} アルコキシカルボニル基、

(e) $-CO-N(R^{15})(R^{16})$

(式中、 R^{15} 及び R^{16} は、それぞれ独立して、水素原子、アリール基(当該アリール基は C_{1-8} アルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基、カルボキシ基及びジ(C_{1-4} アルキル)アミノ基からなる群より選択される1乃至3個の置換基で置換されていてもよい)、芳香族ヘテロ環基、 C_{1-6} アルキル基(当該 C_{1-6} アルキル基はアリール基で置換されていてもよい)を示すか、又はそれらが結合する窒素原子と一緒にあって、さらに窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択される少なくとも1つのヘテロ原子を含有してもよい5乃至7員ヘテロ環を形成してもよい)、

(f) $-N(R^{15})(R^{16})$

(式中、 R^{15} 及び R^{16} は、それぞれ独立して、水素原子又はアリール基を示す)、

(g) $-O-R^{17}$

(式中、 R^{17} はアリール基を示す) 又は

5 (h) C_{3-7} シクロアルキル基

で置換されていてもよい C_{1-6} アルキル基である請求項 18 記載の複素芳香 5 員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩。

20. R^4 が 1 個の C_{1-8} アルキル基で置換されてもよい芳香族ヘテロ環基で置換されたメチル基である請求項 19 記載の複素芳香 5 員環化合物若しくはそのプロ
10 ドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩。

21. 請求項 20 記載の芳香族ヘテロ環がチアゾリル基、オキサゾリル基、ベン
ズイミダゾリル基、ピリジル基又はキノリル基である請求項 20 記載の複素芳香
5 員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩。

22. R^4 が $-CO-N(R^{15})(R^{16})$ (式中、 R^{15} は水素原子を示し、 R^{16} は 1
15 個の C_{1-8} アルキル基で置換されてもよいアリール基を示す) で置換されたメチ
ル基である請求項 19 記載の複素芳香 5 員環化合物若しくはそのプロドラッグ、
又はそれらの医薬上許容し得る塩。

23. 以下の化合物からなる群より選択される請求項 1 乃至 22 のいずれかに記
載の複素芳香 5 員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容
20 し得る塩。

(1) 5-{4-[4-({4-(1-エチル-プロピル)-フェニル}-イソプロピル-アミノ)-メ
チル]-フェニル]-チアゾール-2-イルメトキシ}-ニコチン酸、

(2) 4-{4-[4-({4-(1-エチル-プロピル)-フェニル}-イソプロピル-アミノ)-メ
チル]-フェニル]-チアゾール-2-イルメトキシ}-安息香酸、

25 (3) 6-{4-[4-({4-(1-エチル-プロピル)-フェニル}-イソプロピル-アミノ)-メ
チル]-フェニル]-チアゾール-2-イルメトキシ}-ニコチン酸、

(4) 5-{4-[4-({メチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ)-メチル]-
フェニル]-チアゾール-2-イルメトキシ}-ニコチン酸、

(5) 4-{4-[4-({メチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ)-メチル]-
30 フェニル]-チアゾール-2-イルメトキシ}-安息香酸、

(6) 6-[4-(4-[(4-イソプロピル-フェニル)-(1-プロピル-ブチル)-アミノ]-メ
チル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメトキシ}-ニコチン酸、

- (7) 5-[4-(4-[(4-イソプロピル-フェニル)-(1-プロピル-ブチル)-アミノ]-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメトキシ]-ニコチン酸、
- (8) 5-[4-(4-[(イソブチル-(4-イソプロピル-フェニル)-アミノ]-メチル)-フェニル)-チアゾール-2-イルメトキシ]-ニコチン酸、
- 5 (9) 4-[4-(4-[(4-イソプロピル-フェニル)-(1-プロピル-ブチル)-アミノ]-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメトキシ]-安息香酸、
- (10) 3-[4-(4-[(4-イソプロピル-フェニル)-(1-プロピル-ブチル)-アミノ]-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメトキシ]-安息香酸、
- (11) 6-[4-(4-[(1-エチル-プロピル)-(4-イソプロピル-フェニル)-アミノ]-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメトキシ]-ニコチン酸、
- 10 (12) 5-[4-(4-[(1-エチル-プロピル)-(4-イソプロピル-フェニル)-アミノ]-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメトキシ]-ニコチン酸、
- (13) 4-[4-(4-[(4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ)-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチルチオ)-安息香酸、
- 15 (14) 4-(4-[4-(メチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ)-メチル]-フェニル)-チアゾール-2-イルメチルチオ)-安息香酸、
- (15) 4-(メチル-[4-[4-(メチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ)-メチル]-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル)-スルファモイル)-安息香酸、
- (16) 4-(メチル-[4-[4-(メチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ)-メチル]-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル)-スルファモイル)-酪酸ナトリウム、
- 20 (17) 4-[(4-(4-[4-(シクロヘキシル-フェニルアミノ)-メチル]-フェニル)-チアゾール-2-イル)-メチル-アミノ]-メチル)-安息香酸、
- (18) 4-[(4-(4-[4-(シクロヘキシル-フェニル)-メチル-アミノ]-メチル)-フェニル)-チアゾール-2-イル]-メチル-アミノ)-メチル)-安息香酸、
- 25 (19) 4-[(メチル-[4-[4-(メチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ)-メチル]-フェニル]-チアゾール-2-イル)-アミノ)-メチル]-安息香酸、
- (20) 4-[(4-[4-(4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ)-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イル)-メチル-アミノ)-メチル]-安息香酸、
- 30 (21) (S)-([4-[4-(4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ)-メチル]-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-メチル-アミノ)-フェニル-酢酸、

- (22) (S)-2-((4-[4-([4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ)-メチル]-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-メチル-アミノ)-3-フェニル-プロピオン酸、
- (23) {ベンジル-[4-(4-([4-tert-ブチル-フェニル]-イソブチル-アミノ)-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ}-酢酸、
- (24) {ベンジル-[4-(4-([4-クロロ-フェニル]-イソブチル-アミノ)-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ}-酢酸、
- (25) (ベンジル-[4-[4-([メチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ)-メチル]-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ)-酢酸、
- (26) (ベンジル-[4-[4-([4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ)-メチル]-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ)-酢酸、
- (27) {1-[4-(4-([4-tert-ブチル-フェニル]-イソブチル-アミノ)-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル]-3-フェニル-ウレイド}-酢酸、
- (28) {ベンゾイル-[4-(4-([4-tert-ブチル-フェニル]-イソブチル-アミノ)-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ}-酢酸、
- (29) [[4-(4-([4-tert-ブチル-フェニル]-イソブチル-アミノ)-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル]-(ピリジン-2-イルカルボニル)-アミノ]-酢酸、
- (30) [[4-(4-([4-tert-ブチル-フェニル]-イソブチル-アミノ)-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル]-(ピリジン-3-イルカルボニル)-アミノ]-酢酸、
- (31) {ベンゼンスルホニル-[4-(4-([4-tert-ブチル-フェニル]-イソブチル-アミノ)-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ}-酢酸、
- (32) 2-{4-[4-([4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ)-メチル]-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-1,2,3,4-テトラヒドロ-イソキノリン-3-カルボン酸、
- (33) (S)-2-{4-[4-([4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ)-メチル]-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-1,2,3,4-テトラヒドロ-イソキノリン-3-カルボン酸、
- (34) (S)-2-{4-[4-([メチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ)-メチル]-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-1,2,3,4-テトラヒドロ-イソキノリン-3-カルボン酸、

- (35) (S)-2-[4-(4-[(1-エチル-プロピル)-(4-イソプロピル-フェニル)-アミノ]-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル]-1,2,3,4-テトラヒドロ-イソキノリン-3-カルボン酸、
- (36) 4-[(4-[4-(4-シクロヘキシル-フェノキシメチル)-フェニル]-チアゾール-2-イル)-メチル-アミノ]-安息香酸、
- (37) 4-[(4-[4-(4-シクロヘキシル-フェノキシメチル)-フェニル]-チアゾール-2-イル)-メチル-アミノ]-メチル]-安息香酸、
- (38) 4-[(4-[4-[4-(1,1-ジメチル-プロピル)-フェノキシメチル]-フェニル]-チアゾール-2-イル)-メチル-アミノ]-メチル]-安息香酸、
- 10 (39) 4-[(メチル-(4-[4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル]-チアゾール-2-イル)-アミノ]-メチル]-安息香酸、
- (40) 4-[(メチル-(4-[4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル]-チアゾール-2-イル)-アミノ]-メチル]-安息香酸ナトリウム、
- (41) (S)-[メチル-(4-[4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-フェニル-酢酸、
- 15 (42) (S)-2-[メチル-(4-[4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-3-フェニル-プロピオン酸、
- (43) (ベンジル-[4-[4-(2-tert-ブチル-4-メチル-フェノキシメチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ)-酢酸、
- 20 (44) [ベンジル-(4-[4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (45) 2-(4-[4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル)-1,2,3,4-テトラヒドロ-イソキノリン-3-カルボン酸、
- (46) (S)-2-(4-[4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル)-1,2,3,4-テトラヒドロ-イソキノリン-3-カルボン酸、
- 25 (47) (R)-2-(4-[4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル)-1,2,3,4-テトラヒドロ-イソキノリン-3-カルボン酸、
- (48) 5-(4-[4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル]-チアゾール-2-イルメトキシ)-ニコチン酸、
- 30 (49) 4-(4-[4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル]-チアゾール-2-イルメトキシ)-安息香酸、
- (50) 4-[メチル-(4-[4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル]-チアゾール-2-イルメトキシ)-安息香酸、

- ル}-チアゾール-2-イルメチル)-スルファモイル]-安息香酸、
- (51) 4-[メチル-(4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-スルファモイル]-酪酸、
- (52) 4-([4-[4-(4-シクロヘキシル-フェニルカルバモイル)-フェニル]-チアゾール-2-イル)-メチル-アミノ)-安息香酸、
- 5 (53) 4-([4-[4-(4-シクロヘキシル-フェニルカルバモイル)-フェニル]-チアゾール-2-イル)-メチル-アミノ)-メチル]-安息香酸、
- (54) [ベンジル-(4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニルカルバモイル]-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- 10 (55) [ベンジル-(4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルカルバモイル]-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (56) {ベンジル-[4-(4-{メチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-カルバモイル}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ}-酢酸、
- (57) {ベンジル-[4-(4-{エチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-カルバモイル}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ}-酢酸、
- 15 (58) 5-[4-[4-([4-(2-ヒドロキシ-2-メチル-プロピル)-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ)-メチル]-フェニル]-チアゾール-2-イルメトキシ}-ニコチン酸、
- (59) [[4-(4-([4-(tert-ブチル-フェニル)-イソブチル-アミノ)-メチル]-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-(モルホリン-4-カルボニル)-アミノ]-酢酸、
- 20 (60) 5-[4-[4-([4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ)-メチル]-フェニル]-チアゾール-2-イルメトキシ}-ニコチン酸ナトリウム、
- (61) (S)-2-(4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-1,2,3,4-テトラヒドロ-イソキノリン-3-カルボン酸ナトリウム、
- 25 (62) 5-(4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル)-チアゾール-2-イルメトキシ}-ニコチン酸ナトリウム、
- (63) 3-[4-[4-([4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ)-メチル]-フェニル]-チアゾール-2-イルメトキシ}-5-メトキシ-安息香酸、
- 30 (64) (1-[4-[4-([4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ)-メチル]-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル)-3-フェニル-ウレイド)-酢酸、

- (65) (1-{4-[4-({[4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-3-p-トリル-ウレイド)-酢酸、
- (66) [1-{4-[4-({[4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-3-(4-イソプロピル-フェニル)-ウレイド]-酢酸、
- 5 (67) (1-{4-[4-({[4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-3-メチル-3-フェニル-ウレイド)-酢酸、
- (68) 5-{4-[4-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメトキシ}-ニコチン酸、
- 10 (69) [3-フェニル-1-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-ウレイド]-酢酸、
- (70) (3-(2,6-ジメチル-フェニル)-1-{4-[4-({[4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-ウレイド)-酢酸、
- 15 (71) ({4-[4-({[4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-フェニルカルバモイルメチル-アミノ)-酢酸、
- (72) (1-{4-[4-({[4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-3-イソプロピル-ウレイド)-酢酸、
- 20 (73) 3-{4-[4-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメトキシ}-イソキサゾール-5-カルボン酸、
- (74) 5-[4-(4-{[(2-エチル-ブチル)-(4-イソプロピル-フェニル)-アミノ]-メチル}-フェニル)-チアゾール-2-イルメトキシ]-ニコチン酸、
- 25 (75) [{4-[4-({[4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-(ピペリジン-1-カルボニル)-アミノ]-酢酸、
- (76) 2-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメトキシ)-ニコチン酸、
- 30 (77) [{4-[4-({[4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-(p-トリルカルバモイル-メチル

ル)-アミノ]-酢酸、

(78) {{4-[4-({4-(1-エチル-プロピル)-フェニル}-イソプロピル-アミノ)-メチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル}-[(4-イソプロピル-フェニルカルバモイル)-メチル]-アミノ}-酢酸、

5 (79) (1-{4-[4-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ)-メチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル}-3-メチル-3-フェニル-ウレイド)-酢酸、

(80) (1-{4-[4-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ)-メチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル}-3-p-トリル-ウレイド)-酢酸、

10 (81) ((2,3-ジヒドロ-インドール-1-カルボニル)-{4-[4-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ)-メチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ)-酢酸、

(82) 3-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメトキシ)-ピリジン-2-カルボン酸、

15 (83) {[4-(4-[(2-エチル-ブチル)-(4-イソプロピル-フェニル)-アミノ]-メチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル]-フェニルカルバモイルメチル-アミノ)-酢酸、

(84) {[4-(4-[(2-エチル-ブチル)-(4-イソプロピル-フェニル)-アミノ]-メチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル}-[(4-イソプロピル-フェニルカルバ

20 モイル)-メチル]-アミノ)-酢酸、

(85) 4-(2-{カルボキシメチル-[4-(4-[(2-エチル-ブチル)-(4-イソプロピル-フェニル)-アミノ]-メチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ)-アセチルアミノ)-安息香酸、

(86) 6-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメトキシ)-ピリジン-2-カルボン酸、

(87) 5-{4-[4-({イソブチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ)-メチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメトキシ}-ニコチン酸、

(88) (1-{4-[4-({イソブチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ)-メチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル}-3-フェニル-ウレイド)-酢酸、

30 (89) 5-{4-[4-({4-(1-エチル-プロピル)-フェニル}-イソプロピル-アミノ)-メチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメトキシ}-ニコチン酸メチルエステル、

(90) 4-アミノ-3-{4-[4-({4-(1-エチル-プロピル)-フェニル}-イソプロピ

- ル-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメトキシ)-安息香酸、
- (91) 3-{4-[4-({4-(1-エチル-プロピル)-フェニル}-イソプロピル-アミノ)-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメトキシ)-安息香酸、
- (92) 3-({4-[4-({4-(1-エチル-プロピル)-フェニル}-イソプロピル-アミノ)-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-アミノ)-安息香酸、
- (93) 3-{4-[4-({4-(1-エチル-プロピル)-フェニル}-イソプロピル-アミノ)-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメトキシ)-4-ニトロ-安息香酸、
- (94) ((1H-ベンズイミダゾール-2-イルメチル)-{4-[4-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ)-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-アミノ)-酢酸、
- (95) [フェニルカルバモイルメチル-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (96) [(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-(ピリジン-3-イルカルバモイルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (97) [(4-ジメチルアミノ-フェニルカルバモイル)-メチル]-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (98) [(4-メトキシ-フェニルカルバモイル)-メチル]-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (99) [(イソプロピル-フェニル-カルバモイル)-メチル]-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (100) [(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-(ピリジン-2-イルカルバモイルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (101) [(2-オキソ-2-ピロリジン-1-イル-エチル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (102) [(4-メチル-チアゾール-2-イルメチル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (103) 4-(3-シクロヘキシルメチル-3-{4-[4-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ)-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-ウレイド)-安息香酸、

(104) 4-(3-イソブチル-3-{4-[4-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-ウレイド)-安息香酸、

(105) (1-{4-[4-({イソブチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-3-メチル-3-フェニル-ウレイド)-酢酸、

(106) ({4-[4-({イソブチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-フェニルカルバモイルメチル-アミノ)-酢酸、

10 (107) {{4-[4-({イソブチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-[4-イソプロピル-フェニルカルバモイル]-メチル}-アミノ)-酢酸、

(108) 4-アセチルアミノ-3-{4-[4-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメトキシ}-安息香酸、

(109) 4-(2-ジメチルアミノ-アセチルアミノ)-3-{4-[4-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメトキシ}-安息香酸、

20 (110) ((1H-ベンズイミダゾール-2-イルメチル)-{4-[4-({4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-アミノ)-酢酸、

(111) [(1H-ベンズイミダゾール-2-イルメチル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

(112) 3-{4-[4-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメトキシ}-4-メタンスルホニルアミノ-安息香酸、

(113) 4-イソブチルアミノ-3-{4-[4-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメトキシ}-安息香酸、

30 (114) 4-{4-[4-({4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-3-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-カルボン酸、

- (1 1 5) 4-{4-[4-({4-(1-エチル-プロピル)-フェニル}-イソプロピル-アミノ)-メチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル}-3-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-8-カルボン酸、
- (1 1 6) ({4-[4-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ)-メチル]-フェニル}チアゾール-2-イルメチル)-{メチル-フェニル-アミノ-スルホニル}-アミノ)-酢酸、
- (1 1 7) ([4-イソプロピル-フェニルカルバモイル)-メチル]-{4-[4-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ)-メチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル}-アミノ)-酢酸、
- (1 1 8) ([3,5-ジメチル-フェニルカルバモイル)-メチル]-{4-[4-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ)-メチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル}-アミノ)-酢酸、
- (1 1 9) ([4-ジメチルアミノ-フェニルカルバモイル)-メチル]-{4-[4-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ)-メチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル}-アミノ)-酢酸、
- (1 2 0) ((ベンジルカルバモイル)-メチル)-{4-[4-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ)-メチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル}-アミノ)-酢酸、
- (1 2 1) [{4-[4-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ)-メチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル]-[2-(モルホリン-4-イル)-2-オキソ-エチル]-アミノ]-酢酸、
- (1 2 2) [{4-[4-({4-(1-エチル-プロピル)-フェニル}-イソプロピル-アミノ)-メチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル]-[2-フェノキシ-エチル]-アミノ]-酢酸、
- (1 2 3) [{4-[4-({4-(1-エチル-プロピル)-フェニル}-イソプロピル-アミノ)-メチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル]-[2-フェニルアミノ-エチル]-アミノ]-酢酸、
- (1 2 4) 2-カルボキシメトキシ-5-({4-[4-({4-(1-エチル-プロピル)-フェニル}-イソプロピル-アミノ)-メチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-メチル-アミノ)-安息香酸、
- (1 2 5) 2-カルボキシメトキシ-5-[メチル-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-安息香酸、

(1 2 6) 3-{4-[4-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメトキシ}-4-(2-メチルアミノ-アセチルアミノ)-安息香酸、

(1 2 7) [(4-tert-ブチル-チアゾール-2-イルメチル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

(1 2 8) [フェニル-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

(1 2 9) [(2-フェノキシ-アセチル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

(1 3 0) [(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-(2-p-トリルオキシ-アセチル)-アミノ]-酢酸、

(1 3 1) (エトキシカルボニルメチル-{4-[4-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ)-酢酸 二塩酸塩、

(1 3 2) ((4-tert-ブチル-チアゾール-2-イルメチル)-{4-[4-({[4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ)-酢酸、

(1 3 3) 6-{4-[4-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメトキシ}-ピリジン-2-カルボン酸、

(1 3 4) [(2-ベンジルオキシ-アセチル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

(1 3 5) [[2-(4-イソプロピル-フェノキシ)-アセチル]-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

(1 3 6) [(4,5-ジメチル-チアゾール-2-イルメチル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

(1 3 7) 5-(4-{5-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-チオフェン-2-イル}-チアゾール-2-イルメトキシ)-ニコチン酸、

(1 3 8) ((4-tert-ブチル-チアゾール-2-イルメチル)-{4-[6-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ}-メチル)-ベンゾオキサゾール-2-イ

- ル]-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ)-酢酸、
- (1 3 9) ((1H-ベンズイミダゾール-2-イルメチル)-{4-[6-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ}-メチル)-ベンゾオキサゾール-2-イル]-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ)-酢酸、
- 5 (1 4 0) 5-{4-[6-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ}-メチル)-ベンゾオキサゾール-2-イル]-チアゾール-2-イルメトキシ}-ニコチン酸、
- (1 4 1) [(5-tert-ブチル-チアゾール-2-イルメチル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- 10 酸、
- (1 4 2) [{4-[4-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-(2-オキシ-2-ピペリジン-1-イル-エチル)-アミノ]-酢酸、
- (1 4 3) 6-[メチル-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-ピリジン-2-カルボン酸、
- 15 (1 4 4) ({4-[6-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ}-メチル)-ベンゾオキサゾール-2-イル]-チアゾール-2-イルメチル}-アミノ)-酢酸、
- (1 4 5) (S)-(カルボキシメチル-{4-[4-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-アミノ)-フェニル-酢酸、
- 20 (1 4 6) ((4,5-ジメチル-チアゾール-2-イルメチル)-{4-[4-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-アミノ)-酢酸、
- 25 (1 4 7) [(5-tert-ブチル-オキサゾール-2-イルメチル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (1 4 8) [(1-メチル-1H-ベンズイミダゾール-2-イルメチル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- 30 (1 4 9) (イソブトキシカルボニルメチル-{4-[4-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}

- ル}-アミノ)-酢酸 二塩酸塩、
- (150) (4-[4-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル)-プロポキシカルボニルメチル-アミノ)-酢酸 二塩酸塩、
- 5 (151) 1-(4-[4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル)-ピペリジン-4-カルボン酸 塩酸塩、
- (152) 1-[4-[4-({[4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル)-ピペリジン-4-カルボン酸、
- (153) 4-[4-(4-[4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル)-ピペラジン-1-イル]-安息香酸、
- 10 (154) 4-(4-[4-[4-({[4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル)-ピペラジン-1-イル)-安息香酸、
- (155) 2-[4-(4-[4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル)-ピペラジン-1-イル]-安息香酸、
- 15 (156) 3-[4-(4-[4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル)-ピペラジン-1-イル]-安息香酸、
- (157) 4-(4-[1-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-1H-インドール-3-イル]-チアゾール-2-イルメトキシ)-安息香酸、
- 20 (158) 4-[4-[1-(4-イソプロピル-ベンジル)-5-(1-プロピル-ブチル)-1H-ベンズイミダゾール-2-イル]-チアゾール-2-イルメトキシ)-安息香酸、
- (159) 4-[4-[1-(6-メチル-(ピリジン-2-イルメチル))-5-(1-プロピル-ブチル)-1H-ベンズイミダゾール-2-イル]-チアゾール-2-イルメトキシ)-安息香酸、
- (160) 2-(4-[4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル)-1,2,3,4-テトラヒドロ-イソキノリン-7-カルボン酸、
- 25 (161) 4-[1-(4-[4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル)-ピペリジン-4-イル]-安息香酸、
- (162) 3-[1-(4-[4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル)-ピペリジン-4-イル]-安息香酸、
- 30 (163) 6-[4-[4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル)-カルバモイル]-ニコチン酸、
- (164) 2-[1-(4-[4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]-フェニル]-チ

- アゾール-2-イルメチル)-ピペリジン-4-イル]-安息香酸、
 (165) 1-(4-{1-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-1H-インドール-3-イル}-チアゾール-2-イルメチル)-ピペリジン-4-カルボン酸、
 (166) 2-(4-{1-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-1H-インドール-3-イル}-チアゾール-2-イルメチル)-1,2,3,4-テトラヒドロ-イソキノリン-7-カルボン酸、
 (167) 3-[(4-{1-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-1H-インドール-3-イル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-安息香酸、
 (168) 6-[(2-アミノ-エチル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-カルバモイル]-ニコチン酸 塩酸塩、
 (169) 2-(4-{1-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-1H-ベンズイミダゾール-2-イル}-チアゾール-2-イルメチル)-1,2,3,4-テトラヒドロ-イソキノリン-7-カルボン酸、
 (170) 3-[4-(4-{1-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-1H-ベンズイミダゾール-2-イル}-チアゾール-2-イルメチル)-ピペラジン-1-イル]-安息香酸、
 (171) 4-[1-(4-{1-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-1H-ベンズイミダゾール-2-イル}-チアゾール-2-イルメチル)-ピペリジン-4-イル]-安息香酸、
 (172) 3-[4-(4-{1-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-1H-インドール-3-イル}-チアゾール-2-イルメチル)-ピペラジン-1-イル]-安息香酸、
 (173) 3-(1-{4-[4-(3,4-ジクロロ-ベンジルオキシ)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-ピペリジン-4-イル)-安息香酸、
 (174) 3-(1-{4-[4-(3,5-ビス-トリフルオロメチル-ベンジルオキシ)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-ピペリジン-4-イル)-安息香酸、
 (175) 3-(1-{4-[4-(4-ブトキシ-ベンジルオキシ)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-ピペリジン-4-イル)-安息香酸、
 (176) 5-メチル-2-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸、
 (177) 5-メチル-1-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-1H-ピラゾール-3-カルボン酸、
 (178) 5-tert-ブチル-1-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-1H-ピラゾール-3-カルボン酸、

- (179) 5-tert-ブチル-2-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸、
- (180) (2S, 4R)-4-ヒドロキシ-1-(4-{1-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-1H-インドール-3-イル}-チアゾール-2-イルメチル)-ピロリジン-2-カルボン酸、
- 5 (181) 4-[4-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-ピペリジン-1-イル]-安息香酸、
- (182) 1-(4-{1-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-1H-インドール-3-イル}-チアゾール-2-イルメチル)-1H-インドール-3-カルボン酸、
- (183) 1-(4-{2-フェニル-1-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-1H-イン
- 10 ドール-3-イル}-チアゾール-2-イルメチル)-ピペリジン-4-カルボン酸、
- (184) 3-(1-{4-[4-(4-メチル-3-ニトロ-ベンジルオキシ)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-ピペリジン-4-イル)-安息香酸、
- (185) 2-{4-[1-(4-イソプロピル-ベンジル)-6-(モルホリン-4-イル)-1H-ベンズイミダゾール-2-イル]-チアゾール-2-イルメチル}-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-
- 15 イソキノリン-7-カルボン酸、
- (186) 3-(4-{4-[1-(4-イソプロピル-ベンジル)-6-(モルホリン-4-イル)-1H-ベンズイミダゾール-2-イル]-チアゾール-2-イルメチル}-ピペラジン-1-イル)-安息香酸、
- (187) {ベンジル-[4-(4-{メチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-アミノ}-フェニル)-オキサゾール-2-イルメチル]-アミノ}-酢酸、
- 20 (188) 5-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメトキシ)-ニコチン酸、
- (199) 4-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメトキシ)-安息香酸、
- 25 (190) 4-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチルチオ)-安息香酸、
- (191) 4-(4-{4-[4-(4-シクロヘキシル-ベンジルオキシ)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチルチオ)-安息香酸、
- (192) 4-(4-{4-[4-(4-シクロヘキシル-ベンジルオキシ)-フェニル]-チアゾール-2-イルメタンスルホニル}-安息香酸、
- 30 (193) 4-[メチル-(4-{5-メチル-2-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-スルファモイル]-安息香酸、

- (194) 4-[メチル-(4-{5-メチル-2-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-安息香酸、
- (195) (ベンジル-(4-{5-メチル-2-(4-トリフルオロメチル-ベンジルオキシ)-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ)-酢酸、
- 5 (196) [ベンジル-(4-{5-メチル-2-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (197) [ベンジル-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (198) [ベンジル-(4-{4-[4-(1-エチル-プロピル)-ベンジルオキシ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- 10 (199) (ベンジル-(4-{5-tert-ブチル-2-(4-イソブチル-ベンジルオキシ)-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ)-酢酸、
- (200) [ベンジル-(4-{5-クロロ-2-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- 15 (201) [(4-{4-[4-(1-エチル-プロピル)-ベンジルオキシ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-(4-フルオロ-ベンジル)-アミノ]-酢酸、
- (202) [(4-{4-[4-(1-エチル-プロピル)-ベンジルオキシ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-(4-イソプロピル-ベンジル)-アミノ]-酢酸、
- (203) [(4-{4-[4-(1-エチル-プロピル)-ベンジルオキシ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-(4-トリフルオロメチル-ベンジル)-アミノ]-酢酸、
- 20 (204) [(4-クロロ-ベンジル)-(4-{4-[4-(1-エチル-プロピル)-ベンジルオキシ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (205) [(3,5-ジメチル-ベンジル)-(4-{4-[4-(1-エチル-プロピル)-ベンジルオキシ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- 25 (206) [(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-(ピリジン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (207) [(4-{4-[4-(1-エチル-プロピル)-ベンジルオキシ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-(ピリジン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (208) [(4-{5-メチル-2-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-(ピリジン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- 30 (209) [ベンゾイル-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

- (210) [(4-{4-[4-(1-エチル-プロピル)-ベンジルオキシ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-(4-メチル-ベンゾイル)-アミノ]-酢酸、
- (211) [(4-メトキシ-ベンゾイル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- 5 (212) 2-(4-{5-メチル-2-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-1,2,3,4-テトラヒドロ-イソキノリン-3-カルボン酸、
- (213) (S)-2-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-1,2,3,4-テトラヒドロ-イソキノリン-3-カルボン酸、
- 10 (214) {ベンジル-[4-(4-{[4-(2,2-ジメチル-プロピル)-ベンジル]-メチル-アミノ})-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ}-酢酸、
- (215) {ベンジル-[4-(4-{[trans-4-(4-tert-ブチル-フェニル)-シクロヘキシルメチル]-メチル-アミノ})-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ}-酢酸、
- 15 (216) [ベンジル-(4-{4-[(4-シクロヘキシル-ベンジル)-メチル-アミノ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (217) 3-[ベンジル-(4-{4-[(4-シクロヘキシル-ベンジル)-メチル-アミノ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-プロピオン酸、
- (218) (ベンジル-[4-[4-({2-[4-(2,2-ジメチル-プロピル)-フェニル]-エチル}-メチル-アミノ)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ)-酢酸、
- 20 (219) {ベンジル-[4-(4-{メチル-[4-(trans-4-メチル-シクロヘキシル)-ベンジル]-アミノ})-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ}-酢酸、
- (220) {ベンジル-[4-(4-{[4-(cis-4-フルオロ-シクロヘキシル)-ベンジル]-メチル-アミノ})-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ}-酢酸、
- 25 (221) {ベンジル-[4-(4-{[trans-4-(4-クロロ-フェニル)-シクロヘキシルメチル]-メチル-アミノ})-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ}-酢酸、
- (222) {ベンジル-[4-(4-{[4-(4,4-ジメチル-シクロヘキシル)-ベンジル]-メチル-アミノ})-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ}-酢酸、
- (223) {ベンジル-[4-(4-{メチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-アミノ})-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ}-酢酸、
- 30 (224) (ベンジル-[4-[4-(ビフェニル-4-イルメチル-メチル-アミノ)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ)-酢酸、

- (225) [ベンジル-(4-{4-[(4-シクロヘキシル-ベンジル)-メチル-アミノ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸ナトリウム、
- (226) [ベンジル-(4-{4-[(4-イソブチル-ベンジル)-メチル-アミノ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- 5 (227) {ベンジル-[4-(4-{メチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-アミノ}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ}-酢酸ナトリウム、
- (228) {ベンジル-[4-(4-{[4-(2,2-ジメチル-プロピルチオ)-ベンジル]-メチル-アミノ}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ}-酢酸、
- (229) {ベンジル-[4-(4-{メチル-[4-(3-メチル-ブチルチオ)-ベンジル]-ア
- 10 ミノ}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ}-酢酸、
- (230) [ベンジル-(4-{4-[(4-ジプロピルアミノ-ベンゾイル)-メチル-アミノ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (231) [(4-{4-[エチル-(4-イソプロピル-ベンジル)-アミノ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-(4-イソプロピル-ベンジル)-アミノ]-酢酸、
- 15 (232) [(4-イソプロピル-ベンジル)-(4-{4-[イソプロピル-(4-イソプロピル-ベンジル)-アミノ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (233) [(4-tert-ブチル-ベンジル)-(4-{4-[イソプロピル-(4-イソプロピル-ベンジル)-アミノ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (234) [(4-クロロ-ベンジル)-(4-{4-[(4-イソブチル-ベンジル)-メチル-ア
- 20 ミノ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (235) [{4-[4-(ベンジル-メチル-アミノ)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-アミノ}-酢酸、
- (236) [{4-[4-(ベンジル-メチル-アミノ)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-[4-クロロ-ベンジル]-アミノ]-酢酸、
- 25 (237) [{4-[4-(ベンジル-メチル-アミノ)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-(2-クロロ-ベンジル)-アミノ]-酢酸、
- (238) [{4-[4-(ベンジル-メチル-アミノ)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-(3,4-ジクロロ-ベンジル)-アミノ]-酢酸、
- (239) [{4-(4-{メチル-[4-(trans-4-メチル-シクロヘキシル)-ベンジル]-ア
- 30 ミノ}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル}-(ピリジン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (240) [{4-(4-{メチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-アミノ}-フェニ

- ル)-チアゾール-2-イルメチル]-(ピリジン-2-イルメチル)-アミノ}-酢酸、
 (241) ({4-[4-(ベンジル-メチル-アミノ)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-ナフタレン-1-イルメチル-アミノ)-酢酸、
 (242) ({4-[4-(ベンジル-メチル-アミノ)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-キノリン-2-イルメチル-アミノ)-酢酸、
 (243) ((2-ベンゾ[b]チオフェン-3-イル-アセチル)-{4-[4-(ベンジル-メチル-アミノ)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-アミノ)-酢酸、
 (244) [[2-(4-クロロ-フェニル)-アセチル]-(4-{4-[4-イソブチル-ベンジル]-メチル-アミノ}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
 10 (245) {(4-{4-[4-イソブチル-ベンジル]-メチル-アミノ}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-[2-(4-イソプロピル-フェニル)-アセチル]-アミノ}-酢酸、
 (246) [(4-{4-[4-イソブチル-ベンジル]-メチル-アミノ}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-(3-メチル-ブチル)-アミノ]-酢酸、
 (247) {1-[4-(4-{4-(2,2-ジメチル-プロピル)-ベンジル]-メチル-アミノ}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-3-フェニル-ウレイド}-酢酸、
 15 (248) [ベンゾイル-(4-{4-[4-イソブチル-ベンジル]-メチル-アミノ}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
 (249) {(4-メチル-ベンゾイル)-[4-(4-{メチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-アミノ}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ}-酢酸、
 20 (250) {(4-イソプロピル-ベンゾイル)-[4-(4-{メチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-アミノ}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ}-酢酸ナトリウム、
 (251) (S)-{3-[4-(4-{メチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-アミノ}-フェニル)-チアゾール-2-イル]-3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-イル}-酢酸ナトリウム、
 25 (252) 1-(4-{4-[4-(シクロヘキシル-ベンジル)-メチル-アミノ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-ピペリジン-4-カルボン酸、
 (253) 1-(4-{4-[4-(シクロヘキシル-ベンジル)-メチル-アミノ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-ピペリジン-3-カルボン酸、
 30 (254) 1-(4-{4-[4-(シクロヘキシル-ベンジル)-メチル-アミノ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-4-フェニル-ピペリジン-4-カルボン酸、
 (255) 1-(4-{4-[4-(シクロヘキシル-ベンジル)-メチル-アミノ]-フェニル}-

- チアゾール-2-イルメチル)-4-(3-メチル-ブチル)-ピペリジン-4-カルボン酸、
 (256) 1-[4-(4-{メチル-[4-(trans-4-メチル-シクロヘキシル)-ベンジル]-アミノ}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-4-フェニル-ピペリジン-4-カルボン酸、
- 5 (257) 1-[4-(4-{[trans-4-(4-クロロ-フェニル)-シクロヘキシルメチル]-メチル-アミノ}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-4-フェニル-ピペリジン-4-カルボン酸、
 (258) 2-[4-(4-{メチル-[4-(trans-4-メチル-シクロヘキシル)-ベンジル]-アミノ}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-1,2,3,4-テトラヒドロ-イソキノリン-3-カルボン酸、
- 10 (259) 2-(4-{4-[(4-イソブチル-ベンジル)-メチル-アミノ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-1,2,3,4-テトラヒドロ-イソキノリン-3-カルボン酸、
 (260) 2-[4-(4-{メチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-アミノ}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-1,2,3,4-テトラヒドロ-イソキノリン-3-カルボン酸、
- 15 (261) 2-[4-(4-{[4-(2,2-ジメチル-プロピル)-ベンジル]-メチル-アミノ}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-1,2,3,4-テトラヒドロ-イソキノリン-3-カルボン酸、
 (262) 5-[[4-(4-{[4-(シクロヘキシル-ベンジル)-メチル-アミノ]-フェニル}-チアゾール-2-イル)-メチル-アミノ]-メチル]-フラン-2-カルボン酸、
- 20 (263) 2-[(4-{4-[(4-シクロヘキシル-ベンジル)-メチル-アミノ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-3-フェニル-プロピオン酸、
 (264) [(4-{4-[(4-シクロヘキシル-ベンジル)-メチル-アミノ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-フェニル-酢酸、
- 25 (265) 2-[(4-{4-[(4-シクロヘキシル-ベンジル)-メチル-アミノ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-プロピオン酸、
 (266) 3-(4-クロロ-フェニル)-2-[(4-{4-[(4-イソブチル-ベンジル)-メチル-アミノ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-プロピオン酸、
 (267) [(4-{4-[(4-シクロヘキシル-ベンジル)-メチル-アミノ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-メチル-アミノ]-酢酸、
- 30 (268) 3-[(4-{4-[(4-シクロヘキシル-ベンジル)-メチル-アミノ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-メチル-アミノ]-プロピオン酸、

- (269) 4-[(4-{4-[(4-シクロヘキシル-ベンジル)-メチル-アミノ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-メチル-アミノ]-メチル)-安息香酸、
- (270) 4-[(4-{4-[(4-シクロヘキシル-ベンジル)-メチル-アミノ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-メチル-アミノ]-安息香酸、
- 5 (271) 6-[(4-{4-[(4-シクロヘキシル-ベンジル)-メチル-アミノ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-メチル-アミノ]-ニコチン酸、
- (272) 2-[(4-{4-[(4-イソブチル-ベンジル)-メチル-アミノ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-メチル-アミノ]-3-フェニル-プロピオン酸、
- (273) (S)-2-{メチル-[4-(4-{メチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-アミノ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ}-3-フェニル-プロピオン酸、
- 10 (274) (S)-{メチル-[4-(4-{メチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-アミノ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ}-フェニル-酢酸、
- (275) {[4-(4-{[4-(2,2-ジメチル-プロピル)-ベンジル]-メチル-アミノ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-メチル-アミノ}-フェニル-酢酸、
- 15 (276) 2-{[4-(4-{[4-(2,2-ジメチル-プロピル)-ベンジル]-メチル-アミノ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-メチル-アミノ}-3-フェニル-プロピオン酸、
- (277) {カルボキシメチル-[4-(4-{メチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-アミノ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ}-酢酸、
- 20 (278) [(4-{4-[(4-シクロヘキシル-ベンジル)-メチル-アミノ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-(3-メチル-ブチル)-アミノ]-酢酸、
- (279) {(3-メチル-ブチル)-[4-(4-{メチル-[4-(trans-4-メチル-シクロヘキシル)-ベンジル]-アミノ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ}-酢酸、
- 25 (280) [(4-{4-[(4-イソブチル-ベンジル)-メチル-アミノ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-(3-メチル-ブチル)-アミノ]-酢酸、
- (281) 5-[4-(4-{メチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-アミノ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメトキシ]-ニコチン酸、
- (282) 4-[4-(4-{メチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-アミノ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメトキシ]-安息香酸、
- 30 (283) 4-[4-(4-{メチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-アミノ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチルチオ]-安息香酸、

- (284) 4-[(4-{4-[(4-シクロヘキシル-ベンジル)-メチル-アミノ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-スルファモイル]-安息香酸、
- (285) 4-[(4-{4-[(4-(4,4-ジメチル-シクロヘキシル)-ベンジル]-メチル-アミノ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-メチル-スルファモイル]-安息香酸、
- 5 (286) [(4-{4-[(4-(4,4-ジメチル-シクロヘキシル)-ベンジル]-メチル-アミノ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-メチル-スルファモイル]-酢酸、
- (287) 4-[(4-{4-[(4-シクロヘキシル-ベンジル)-メチル-アミノ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-メチル-スルファモイル]-安息香酸、
- (288) 3-[(4-{4-[(4-シクロヘキシル-ベンジル)-メチル-アミノ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-メチル-スルファモイル]-安息香酸、
- 10 (289) [(4-{4-[(4-シクロヘキシル-ベンジル)-メチル-アミノ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-メチル-スルファモイル]-酢酸、
- (290) 4-[(4-{4-[(4-(4,4-ジメチル-シクロヘキシル)-ベンジル]-メチル-アミノ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-メチル-スルファモイル]-酪酸、
- 15 (291) [(4-{4-[(4-シクロヘキシル-ベンジル)-メチル-アミノ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-イソブチル-スルファモイル]-酢酸、
- (292) N-(4-{4-[(4-シクロヘキシル-ベンジル)-メチル-アミノ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-オキサミド酸、
- (293) {ベンジル-[4-(4-{4-[(1-プロピル-ブチル)-ベンジル]-メチル-アミノカルボニル]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ}-酢酸、
- 20 (294) N-(4-{4-[(4-シクロヘキシル-ベンジル)-メチル-アミノ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル)-N-メチル-テレフタルアミド酸、
- (295) {ベンジル-[4-(4-{メチル-[4-(trans-4-メチル-シクロヘキシル)-ベンジル]-アミノ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメトキシカルボニル]-アミノ}-
- 25 酢酸、
- (296) [3-(4-{4-[(4-シクロヘキシル-ベンジル)-メチル-アミノ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-3-メチル-ウレイド]-酢酸、
- (297) (シクロヘキシルメチル-[4-[6-(3,4-ジクロロ-ベンジルオキシ)-ベンゾオキサゾール-2-イル]-チアゾール-2-イル]-アミノ)-酢酸、
- 30 (298) [4-(4-{4-[(4-シクロヘキシル-ベンジル)-メチル-アミノ]}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-ピペラジン-1-イル]-酢酸、
- (299) (S)-2-(4-{4-[(4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]}-フェニル)-

チアゾール-2-イルメチル)-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-イソキノリン-3-カルボン酸
ナトリウム、

(300) 5-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]-フェニル}-チア
ゾール-2-イルメトキシ)-ニコチン酸ナトリウム、

5 (301) 5-(4-{2-メチル-4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]-フェニ
ル}-チアゾール-2-イルメトキシ)-ニコチン酸、

(302) 5-(4-{3-メトキシ-4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]-フェ
ニル}-チアゾール-2-イルメトキシ)-ニコチン酸、

(303) [(4-{2-メチル-4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]-フェニ
10 ル}-チアゾール-2-イルメチル)-フェニルカルバモイルメチル-アミノ]-酢酸、

(304) [(4-イソプロピル-フェニルカルバモイル)-メチル]-(4-{2-メチル-
4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチ
ル)-アミノ]-酢酸、

(305) 2-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]-フェニル}-チア
15 ゾール-2-イルメチル)-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-イソキノリン-3-カルボン酸、

(306) [(4-{3-メトキシ-4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]-フェ
ニル}-チアゾール-2-イルメチル)-フェニルカルバモイルメチル-アミノ]-酢酸、

(307) [(4-イソプロピル-フェニルカルバモイル)-メチル]-(4-{3-メトキ
シ-4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]-フェニル}-チアゾール-2-イル
20 メチル)-アミノ]-酢酸、

(308) [(4-{2-メチル-4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]-フェニ
ル}-チアゾール-2-イルメチル)-チアゾール-4-イルメチル-アミノ]-酢酸、

(309) [(4-{2-メチル-4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]-フェニ
ル}-チアゾール-2-イルメチル)-(2-メチル-チアゾール-4-イルメチル)-アミノ]-
25 酢酸 塩酸塩、

(310) [(ベンジルカルバモイル)-メチル]-(4-{2-メチル-4-[4-(1-プロピル-
ブチル)-ベンジルオキシ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸
塩酸塩、

(311) [(1H-ベンズイミダゾール-2-イルメチル)-(4-{2-メチル-4-[4-(1-プ
30 ロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミ
ノ]-酢酸、

(312) [(4-tert-ブチル-チアゾール-2-イルメチル)-(4-{1-[4-(1-プロピル-

ブチル)-ベンジル]-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-キノリン-6-イル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

(3 1 3) 1-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-ピペリジン-4-カルボン酸 塩酸塩、

5 (3 1 4) 4-[4-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-ベンジルオキシ]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-ピペラジン-1-イル]-安息香酸、

(3 1 5) 4-{4-[5-(1-エチル-プロピル)-1-(4-イソプロピル-ベンジル)-1H-ベンズイミダゾール-2-イル]-チアゾール-2-イルメトキシ}-安息香酸エチルエステル、

10 (3 1 6) 4-{4-[5-(1-エチル-プロピル)-1-(4-イソプロピル-ベンジル)-1H-ベンズイミダゾール-2-イル]-チアゾール-2-イルメトキシ}-安息香酸、

(3 1 7) 4-{4-[1-(4-アセチル-ベンジル)-5-(1-エチル-プロピル)-1H-ベンズイミダゾール-2-イル]-チアゾール-2-イルメトキシ}-安息香酸、

(3 1 8) 4-{4-[1-(4-アセチル-ベンジル)-6-(1-エチル-プロピル)-1H-ベンズイミダゾール-2-イル]-チアゾール-2-イルメトキシ}-安息香酸、

15 (3 1 9) 4-{4-[1-シクロヘキシルメチル-5-(1-エチル-プロピル)-1H-ベンズイミダゾール-2-イル]-チアゾール-2-イルメトキシ}-安息香酸、

(3 2 0) [(1-メチル-1H-ベンズイミダゾール-2-イルメチル)-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミ

20 ノ]-酢酸、

(3 2 1) 5-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメトキシ)-ニコチン酸、

(3 2 2) 5-{4-[4-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ)-メチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメトキシ}-ニコチン酸、

25 (3 2 3) 5-{4-[4-({[4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ)-メチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメトキシ}-ニコチン酸、

(3 2 4) 5-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメトキシ)-ニコチン酸、

(3 2 5) [(1H-ベンズイミダゾール-2-イルメチル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

30 (3 2 6) 6-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメトキシ)-ピリジン-2-カルボン酸、

- (3 2 7) [(1H-ベンズイミダゾール-2-イルメチル)-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (3 2 8) [(4-イソプロピル-フェニルカルバモイル)-メチル]-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- 5 (3 2 9) [フェニルカルバモイルメチル-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (3 3 0) ((4-[4-({4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ)-メチル]-フェニル)-チオフェン-2-イルメチル)-フェニルカルバモイルメチル-アミノ)-酢酸、
- 10 (3 3 1) ((4-tert-ブチル-チアゾール-2-イルメチル)-{4-[4-({4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ)-メチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ)-酢酸、
- (3 3 2) [(5-tert-ブチル-チアゾール-2-イルメチル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- 15 (3 3 3) ((1H-ベンズイミダゾール-2-イルメチル)-{4-[4-({4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ)-メチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ)-酢酸、
- 20 (3 3 4) [(4-tert-ブチル-チアゾール-2-イルメチル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (3 3 5) [フェニルカルバモイルメチル-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- 25 (3 3 6) 5-[5-[4-({4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ)-メチル]-フェニル]-チオフェン-2-イルメトキシ)-ニコチン酸、
- (3 3 7) 5-[5-[4-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ)-メチル]-フェニル]-チオフェン-2-イルメトキシ)-ニコチン酸、
- (3 3 8) ((4-tert-ブチル-チアゾール-2-イルメチル)-{5-[4-({4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ)-メチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ)-酢酸、
- 30 (3 3 9) ((4-tert-ブチル-チアゾール-2-イルメチル)-{5-[4-({イソプロピル-

[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ}-メチル)-フェニル]-チオフェン-2-イルメチル}-アミノ)-酢酸、

(340) ((1H-ベンズイミダゾール-2-イルメチル)-{5-[4-([4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ)-メチル]-フェニル]-チオフェン-2-イルメチル}-アミノ)-酢酸、

(341) ((1H-ベンズイミダゾール-2-イルメチル)-{5-[4-([イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ)-メチル]-フェニル]-チオフェン-2-イルメチル}-アミノ)-酢酸、

(342) [(4,5-ジメチル-チアゾール-2-イルメチル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

(343) (S)-2-{4-[4-([4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ)-メチル]-フェニル]-チオフェン-2-イルメチル}-1,2,3,4-テトラヒドロ-イソキノリン-3-カルボン酸、

(344) {[4-[4-([4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ)-メチル]-フェニル]-チオフェン-2-イルメチル}-[(4-イソプロピル-フェニルカルバモイル)-メチル]-アミノ)-酢酸、

(345) (S)-2-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-1,2,3,4-テトラヒドロ-イソキノリン-3-カルボン酸、

(346) [[(4-イソプロピル-フェニルカルバモイル)-メチル]-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

(347) (S)-2-{5-[4-([4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ)-メチル]-フェニル]-チオフェン-2-イルメチル}-1,2,3,4-テトラヒドロ-イソキノリン-3-カルボン酸、

(348) [(5-tert-ブチル-オキサゾール-2-イルメチル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

(349) [(1-メチル-1H-ベンズイミダゾール-2-イルメチル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

- (350) 6-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメトキシ)-ピリジン-2-カルボン酸、
- (351) 6-{4-[4-({4-(1-エチル-プロピル)-フェニル}-イソプロピル-アミノ)-メチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメトキシ}-ピリジン-2-カルボン酸、
- 5 (352) ((5-tert-ブチル-チアゾール-2-イルメチル)-{4-[4-({4-(1-エチル-プロピル)-フェニル}-イソプロピル-アミノ)-メチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ)-酢酸、
- (353) [{4-[4-({4-(1-エチル-プロピル)-フェニル}-イソプロピル-アミノ)-メチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル]-(1-メチル-1H-ベンズイミダ
- 10 ザゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (354) [(4-tert-ブチル-チアゾール-2-イルメチル)-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (355) [(5-[4-({4-(1-エチル-プロピル)-フェニル}-イソプロピル-アミノ)-メチル]-フェニル]-チオフェン-2-イルメチル)-(1-メチル-1H-ベンズイミダ
- 15 ザゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (356) [(5-tert-ブチル-チアゾール-2-イルメチル)-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- 20 (357) [(1-メチル-1H-ベンズイミダゾール-2-イルメチル)-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸ナトリウム、
- (358) ビス {[(1-メチル-1H-ベンズイミダゾール-2-イルメチル)-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸} カルシウム、
- 25 (359) [(1-メチル-1H-ベンズイミダゾール-2-イルメチル)-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸 トルエン-4-スルホン酸塩、
- (360) 5-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメトキシ)-ニコチン酸 硫酸塩、
- 30 (361) [(1-メチル-1H-ベンズイミダゾール-2-イルメチル)-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-カルボニル)-アミ

- ノ]-酢酸、
- (362) [(5-tert-ブチル-チアゾール-2-イルメチル)-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-カルボニル)-アミノ]-酢酸、
- 5 (363) [(4-イソプロピル-ベンジル)-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-カルボニル)-アミノ]-酢酸、
- (364) [(4-ジメチルアミノ-ベンジル)-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-カルボニル)-アミノ]-酢酸、
- (365) [(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオ
- 10 フェン-2-カルボニル)-(ピリジン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (366) [(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-カルボニル)-ピリジン-3-イルメチル-アミノ]-酢酸、
- (367) 5-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメトキシ)-ニコチン酸 メタンスルホン酸塩、
- 15 (368) [メタンスルホニル-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (369) 5-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメトキシ)-ニコチン酸ナトリウム、
- (370) 5-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チ
- 20 オフェン-2-イルメトキシ)-ニコチン酸 塩酸塩、
- (371) 4-[4-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-カルボニル)-ピペラジン-1-イル]-安息香酸、
- (372) 4-[1-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-カルボニル)-ピペリジン-4-イル]-安息香酸、
- 25 (373) [(1-メチル-1H-ベンズイミダゾール-2-イルメチル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸 塩酸塩、
- (374) [(1-メチル-1H-ベンズイミダゾール-2-イルメチル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミ
- 30 ノ]-酢酸 硫酸塩、
- (375) 4-(2-ジメチルアミノ-アセチルアミノ)-3-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメトキシ)-安息香酸、

- (376) 4-イソブチリルアミノ-3-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメトキシ)-安息香酸、
- (377) 4-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメトキシ)-安息香酸、
- 5 (378) 4-(メタンスルホニル-メチル-アミノ)-3-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメトキシ)-安息香酸、
- (379) 4-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチルチオ)-安息香酸、
- (380) 4-アミノ-3-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメトキシ)-安息香酸、
- 10 (381) 1-{5-[1-(4-シクロヘキシル-ベンジル)-1H-インドール-3-イル]-チオフェン-2-イルメチル}-4-フェニル-ピペリジン-4-カルボン酸 塩酸塩、
- (382) (ベンジル-{5-[1-(4-シクロヘキシル-ベンジル)-1H-インドール-3-イル]-チオフェン-2-イルメチル}-アミノ)-酢酸 塩酸塩、
- 15 (383) [(メチル-フェニル-スルファモイル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (384) [(5-tert-ブチル-チアゾール-2-イルメチル)-(5-{4-[4-(シクロヘキシル-フェニル)-メチル-カルバモイル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- 20 (385) [(5-{4-[4-(シクロヘキシル-ベンジル)-エチル-アミノ]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-(ピリジン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (386) [(5-{4-[4-(シクロヘキシル-ベンジル)-エチル-アミノ]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-(2-フェノキシ-エチル)-アミノ]-酢酸、
- (387) 4-{1-[4-(4-{[trans-4-(4-tert-ブチル-フェニル)-シクロヘキシルメチル]-エチル-アミノ}-フェニル)-チオフェン-2-イルメチル]-ピペリジン-4-イル}-安息香酸、
- 25 (388) [[2-(4-イソプロピル-フェノキシ)-アセチル]-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- 30 (389) [(4-イソプロピル-ベンゾイル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (390) [(3-メチル-ブチル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

- ル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (391) [3-メチル-3-フェニル-1-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-ウレイド]-酢酸、
- (392) 2-(4-{3-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-1,2,3,4-テトラヒドロ-イソキノリン-7-カルボン酸、
- 5 (393) 4-[4-(5-{4-[4-(trans-4-メチル-シクロヘキシル)-ベンジルオキシ]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-ピペラジン-1-イル]-安息香酸、
- (394) [(2-クロロ-5-トリフルオロメチル-ベンジル)-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- 10 (395) 3-{[カルボキシメチル-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-メチル}-安息香酸、
- (396) [(4-メトキシ-ベンジル)-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- 15 (397) [(4-メチルチオ-ベンジル)-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (398) 4-[シクロヘキシルメチル-(5-{4-[4-(trans-4-メチル-シクロヘキシル)-ベンジルオキシ]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-スルファモイル]-安息香酸、
- 20 (399) 4-[3-シクロヘキシルメチル-3-(5-{4-[4-(trans-4-メチル-シクロヘキシル)-ベンジルオキシ]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-ウレイド]-安息香酸、
- (400) [ベンズヒドリル-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- 25 (401) [[2-オキソ-2-(4-ピロリジン-1-イル-フェニル)-エチル]-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸エチルエステル 塩酸塩、
- (402) [(1-メチル-1H-ベンズイミダゾール-2-イルメチル)-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸エチルエステル、
- 30 (403) 3-(ベンジル-{5-[1-(4-シクロヘキシル-ベンジル)-2,3-ジヒドロ-1H-インドール-5-イル]-チオフェン-2-イルメチル}-アミノ)-プロピオン酸、

- (404) [ベンジル-(4-{4-[2-(2,2-ジメチル-プロピル)-ベンズイミダゾール-1-イルメチル]-フェニル}-チオフエン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (405) [(1-メチル-1H-インドール-3-イルメチル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフエン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- 5 (406) [(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフエン-2-イルメチル)-キノリン-2-イルメチル-アミノ]-酢酸、
- (407) [ベンゾチアゾール-2-イルメチル-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフエン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (408) [(1-ベンジル-1H-イミダゾール-2-イルメチル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフエン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- 10 (409) [(1H-インドール-5-イルメチル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフエン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (410) [(4-イミダゾール-1-イル-ベンジル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフエン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- 15 (411) [ベンゾフラン-2-イルメチル-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフエン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (412) [[2,2']ピチオフエニル-5-イルメチル-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフエン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- 20 (413) [(2-フェニル-1H-イミダゾール-4-イルメチル)-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフエン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (414) [(3-フェニル-1H-ピラゾール-4-イルメチル)-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフエン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- 25 (415) [ベンゾオキサゾール-2-イルメチル-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフエン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (416) [ベンゾ[b]チオフエン-2-イルメチル-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフエン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- 30 (417) [(4-フェニル-チオフエン-2-イルメチル)-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフエン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、
- (418) [ベンゾチアゾール-2-イル-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシ

シメチル]-フェニル)-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

(419) [(5-クロロ-チオフェン-2-スルホニル)-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

(420) [(1-ジエチルカルバモイルメチル-1H-ベンズイミダゾール-2-イルメチル)-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

(421) (S)-({4-[2-(4-シクロヘキシル-ベンジルオキシ)-5-メチル-フェニル]-チオフェン-2-イルメチル}-メチル-アミノ)-3-フェニル-プロピオン酸、

(422) [ベンジル-(4-{4-[(4-ブトキシ-ベンゼンスルホニル)-エチル-アミノ]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

(423) N-{4-[2-(4-シクロヘキシル-ベンジルオキシ)-5-メチル-フェニル]-チオフェン-2-イルメチル}-N-(2-メチル-ベンゾチアゾール-6-イル)-オキサミド酸、

(424) (ベンジル-{4-[4-(3,5-ジクロロ-フェノキシメチル)-フェニル]-チオフェン-2-イルメチル}-アミノ)-酢酸、

(425) [(1-アリル-1H-ベンズイミダゾール-2-イルメチル)-(5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸及び

(426) [[4-(4-クロロ-フェニル)-チアゾール-2-イル]-{5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル}-アミノ]-酢酸。

24. 以下の化合物からなる群より選択される請求項1乃至23のいずれかに記載の複素芳香5員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩。

(1) (S)-2-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-3-カルボン酸、

(2) {[4-[4-({[4-(1-エチル-プロピル)-フェニル]-イソプロピル-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-[(4-イソプロピル-フェニルカルバモイル)-メチル]-アミノ}-酢酸、

(3) 4-(3-イソブチル-3-{4-[4-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ}-メチル)-フェニル]-チア

ゾール-2-イルメチル}-ウレイド)-安息香酸、

(4) ({4-[4-({イソブチル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-フェニルカルバモイルメチル-アミノ)-酢酸、

5 (5) [(4-イソプロピル-フェニルカルバモイル)-メチル]-{4-[4-({イソプロピル-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェニル]-アミノ}-メチル)-フェニル]-チアゾール-2-イルメチル}-アミノ)-酢酸、

(6) [(4-tert-ブチル-チアゾール-2-イルメチル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

(7) [(4,5-ジメチル-チアゾール-2-イルメチル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

(8) [(5-tert-ブチル-チアゾール-2-イルメチル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

(9) [(2-(4-イソプロピル-フェノキシ)アセチル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

20 (10) 4-[4-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チアゾール-2-イルメチル)-ピペラジン-1-イル]-安息香酸、

(11) {ベンジル-[4-(4-{メチル-[4-(1-プロピル-ブチル)ベンジル]アミノ}-フェニル)-チアゾール-2-イルメチル]-アミノ}-酢酸、

(12) [(1-メチル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イルメチル)-5-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメチル)-アミノ]-酢酸、

(13) 5-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2-イルメトキシ)-ニコチン酸、

30 (14) [(1H-ベンゾイミダゾール-2-イルメチル)-(4-{4-[4-(1-プロピル-ブチル)-フェノキシメチル]-フェニル}-チオフェン-2

－イルメチル)－アミノ]－酢酸、

(15) [(1H-ベンゾイミダゾール-2-イルメチル)－(5－{4－[4－(1-プロピル-ブチル)－フェノキシメチル]－フェニル}－チオフエン-2-イルメチル)－アミノ]－酢酸、

5 (16) [(4-イソプロピル-フェニルカルバモイル)－メチル]－(5－{4－[4－(1-プロピル-ブチル)－フェノキシメチル]－フェニル}－チオフエン-2-イルメチル)－アミノ]－酢酸、

(17) (S)－2－{4－[4－({[4－(1-エチル-プロピル)－フェニル]－イソプロピル-アミノ}－メチル)－フェニル]－チオフエン-2-イルメチル}－1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-イソキノリン-3-カルボン酸、

10 (18) {[4－[4－({[4－(1-エチル-プロピル)－フェニル]－イソプロピル-アミノ}－メチル)－フェニル]－チオフエン-2-イルメチル}－[(4-イソプロピル-フェニルカルバモイル)－メチル]－アミノ}－酢酸、

(19) [(1-メチル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イルメチル)－(4－{4－[4－(1-プロピル-ブチル)－フェノキシメチル]－フェニル}－チオフエン-2-イルメチル)－アミノ]－酢酸及び

(20) [(4-tert-ブチル-チアゾール-2-イルメチル)－(5－{4－[4－(1-プロピル-ブチル)－フェノキシメチル]－フェニル}－チオフエン-2-イルメチル)－アミノ]－酢酸。

20 25. 請求項1乃至24のいずれかに記載の複素芳香5員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩と医薬上許容し得る担体とを含有する医薬組成物。

26. 請求項1乃至24のいずれかに記載の複素芳香5員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩と医薬上許容し得る担体とを含有する受容体型チロシンキナーゼネガティブ調節因子阻害用医薬組成物。

27. 請求項1乃至24のいずれかに記載の複素芳香5員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩と医薬上許容し得る担体とを含有する蛋白質チロシンホスファターゼ1B阻害用医薬組成物。

28. 請求項1乃至24のいずれかに記載の複素芳香5員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩と医薬上許容し得る担体とを含有する糖尿病予防又は治療用医薬組成物。

29. 請求項1乃至24のいずれかに記載の複素芳香5員環化合物若しくはその

プロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩と医薬上許容し得る担体とを含有する高脂血症予防又は治療用医薬組成物。

30. 請求項1乃至24のいずれかに記載の複素芳香5員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩と医薬上許容し得る担体とを含有する肥満症予防又は治療用医薬組成物。

31. 請求項1乃至24のいずれかに記載の複素芳香5員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩と医薬上許容し得る担体とを含有する糖尿病合併症予防又は治療用医薬組成物。

32. 高脂血症治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする請求項25記載の医薬組成物。

33. 高脂血症治療薬が、HMG-CoA レダクターゼ阻害剤(スタチン)、フィブラート、TNFSF6 発現阻害剤、HDL-コレステロール増加剤、アポ A1 発現増強剤、SPP1 (オステオポンチン) 発現阻害剤、ペルオキシソーム増殖因子活性化受容体 (PPAR) に作用する薬剤、PPAR α 作動剤、リパーゼ清澄化因子刺激剤、コレステロール拮抗剤、血小板凝固拮抗剤、抗酸化剤、コレステロール生合成阻害剤、LDL-受容体アップレギュレーター、胆汁酸封鎖剤、コレステロール吸収阻害剤及びニコチン酸からなる群より選択される1以上の薬剤である請求項32記載の医薬組成物。

34. 高脂血症治療薬が、ロバスタチン、プラバスタチン (エプタスタチン) ナトリウム、フルバスタチン (フルインドステイニン) ナトリウム、ロスバスタチンカルシウム、アトルバスタチンカルシウム、シンバスタチン (シンビノリン)、ピタバスタチン (イタバスタチン、ニスバスタチン) カルシウム、ロニフィブラート (ロニフィブラート)、ビニフィブラート (ビニフィブラート)、クリノフィブラート、シプロフィブラート、クロフィブラート、エトフィブラート、フェノフィブラート、ベザフィブラート、ゲンフィプロジル、アシピモクス、エイコサペンタエン酸 (イコサペント、イコペネート、イコサペント酸) エチルエステル、プロブコール、ポリコサノール、塩酸コレセベラム、コレステラミン (コレステラミン樹脂)、塩酸コレステポール、コレステミド (コレステラン)、エゼチミブ及びナイアシン (ニコチン酸) からなる群より選択される1以上の薬剤である請求項33記載の医薬組成物。

35. 糖尿病治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする請求項25記載の医薬組成物。

36. 糖尿病治療薬が、インスリン分泌促進剤、ビグアナイド剤、 α -グルコシダーゼ阻害剤、インスリン製剤、インスリンアナログ、インスリン感受性増強剤、IL-11、抗 CD25 (IL-2 受容体) 剤、アンギオテンシン(AT1)拮抗剤、アンギオテンシン変換酵素 (ACE) 阻害剤、アルドースレダクターゼ阻害剤、抗酸化剤、カルニチンアセチルトランスフェラーゼ刺激剤、抗鬱剤、グルココルチコイド、レチリン、ラジカル形成作動剤及びトランスケトラーゼ活性化剤からなる群より選択される 1 以上の薬剤である請求項 35 記載の医薬組成物。

37. 糖尿病治療薬が、ナテグリニド、グリメピリド、グリベンクラミド、グリクラジド、アセトヘキサミド、トルブタミド、グリクロピラミド、トラザミド、
10 グリブゾール、グリピジド、グルボルヌリド、グリキドン、レパグリニド、塩酸メトホルミン、塩酸ブホルミン、ボグリボース、アカルボース、エパルレストット、ミグリトール、インスリン、塩酸ピオグリタゾン、マレイン酸ロシグリタゾン、ピコリン酸クロム/ピオチン、V-411、組換えヒトインターロイキン-11、ダシリキシマブ (ダシリツマブ)、ロサルタンカリウム、カプトプリル、塩酸イミ
15 ダプリル、 α -リボ酸、塩酸レバセカルニン(アセチル-L-カルニチン、アセチルレボカルニチン)、カプトプリル、レチリン、ベルテポルフィン、ベンフォチアミン及びフルオシノロンアセトニドからなる群より選択される 1 以上の薬剤である請求項 36 記載の医薬組成物。

38. 肥満症治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする請求項 25 記載の
20 医薬組成物。

39. 肥満症治療薬が、マジンドール、リパーゼ阻害剤、5-HT/ノルエピネフリン再取り込みデュアルインヒビター、5-HT 再取り込み阻害剤、ハーバルエフェドリン及びカフェインを含むサプリメント、ヒト絨毛性性腺刺激ホルモン、アドレナリン受容体作動剤、メタアンフェタミン、フェンタミン及びアムフェプラモン
25 ンからなる群より選択される 1 以上の薬剤である請求項 38 記載の医薬組成物。

40. 肥満症治療薬が、マジンドール、オルリスタット、塩酸シブトラミン-水和物、塩酸フルオキセチン、絨毛性性腺刺激ホルモン (ヒト)、NCP システムを用いる VNS 療法、メタラミノール、塩酸 d-メタアンフェタミン、フェンテルミン、塩酸アムフェプラモン(ジエチルプロピオン)、塩酸ベンズフェタミン及び酒
30 石酸フェンジメトラジンからなる群より選択される 1 以上の薬剤である請求項 39 記載の医薬組成物。

41. 高血圧症治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする請求項 25 記載

の医薬組成物。

- 4 2. 高血圧症治療薬が、チアジド、アルドステロン拮抗剤、アドレナリン作動性ニューロン遮断薬、カルシウムチャネル遮断薬、ドーパミン D2 拮抗剤、 β -アドレナリン受容体拮抗剤、 $\alpha 2$ -アドレナリン受容体作動剤、グアニル酸シクラーゼ活性化剤、 $\beta 1$ -アドレナリン受容体拮抗剤、 $\alpha 1$ -アドレナリン受容体拮抗剤、抗酸化剤、アンギオテンシン-I 変換酵素 (ACE) 阻害剤、 Na^+/H^+ 交換阻害剤、 α -アドレナリン受容体拮抗剤、酸化窒素供与体、5-HT₂ 拮抗剤、K(ATP)チャネル活性化剤、カリウム保持性利尿性プロスタグランジンシンターゼ刺激剤、イミダゾリン I₁ 受容体作動剤、アンギオテンシン AT₁ 拮抗剤、ドーパミン D₁ 作動剤、グアニル酸シクラーゼ刺激剤、エンドセリン ETA 受容体拮抗剤、エンドセリン ETB 受容体拮抗剤、NOS₃ 発現増強剤、プロスタサイクリンアナログ、プロスタグランジン、アンギオテンシン II 拮抗剤、電解質吸収作動剤、ニコチン拮抗剤、ドーパミン D₂ 作動剤、プロラクチン阻害剤、血小板活性化因子 (PAF) 拮抗剤、血小板凝固拮抗剤、腫瘍壊死因子拮抗剤、Rho キナーゼ阻害剤、PPAR α 作動剤、
- 15 AMPA 受容体調節剤、GABA (A) 受容体拮抗剤及びホスホジエステラーゼ V (PDE5A) 阻害剤からなる群より選択される 1 以上の薬剤である請求項 4 1 記載の医薬組成物。

- 4 3. 高血圧症治療薬が、クロロチアジド、ヒドロクロロチアジド、ヒドロフルメチアジド、メチクロチアジド、ポリチアジド、サイパミド、シクロペンチアジド、ベンドロフルメチアジド (ベンドロフルアジド)、スピロラクトン、エポキシメクスレノン (エプレレノン)、モノ硫酸グアナチジン、硫酸グアナドレル、ペラパミル、塩酸プロプラノロール、塩酸アルブレンロール、ピンドロール、塩酸オクスプレノロール、マレイン酸チモロール、塩酸ソタロール、塩酸アセブトロール、塩酸カルテオロール、硫酸メピンドロール、塩酸アロチノロール、塩酸インデノロール、塩酸タータトロール、塩酸セリプロロール、塩酸チリソロール、ネビボロール、硫酸ペンブトロール、ナドロール、塩酸クロラノロール、塩酸ベバントール (ベバントロール)、クロニジン、塩酸グアンファシン、塩酸ジルチアゼム、塩酸ニカルジピン、ニトレンジピン、フェロジピン、ニルバジピン、ニバジピン、ニソルジピン、塩酸ベニジピン、ベシル酸アムロジピン、塩酸フラニジピン (マニジピン)、ラシジピン、イスラジピン、塩酸バルニジピン (メピロジピン)、塩酸エホニジピン エタノール、シナルジピン (シルニジピン)、アラニジピン、塩酸レルカニジピン (マスニジピン)、アゼルニジピン、アムロジピ
- 20
- 25
- 30

- ン、マニジピン（フラニジピン）、ニトロプルシドナトリウム、アテノロール、酒石酸メトプロロール、塩酸ベタキシロール、ボピンドロール、フマル酸ビソプロロール、塩酸エスモロール、カルベジロール、コハク酸メトプロロール、タリノロール、塩酸プラゾシン、ウラピジル、塩酸インドラミン、塩酸ブナゾシン、
- 5 塩酸テラゾシン、メシル酸ドキサゾシン、ウラピジル、ニフェジピン、カプトプリル、マレイン酸エナラプリル、リシノプリル、ペリンドプリル、アラセプリル、ラミプリル、塩酸キナプリル、塩酸デラプリル、塩酸ベナゼプリル、シラザプリル、フォシノプリラート、フォシノプリルナトリウム、トランドラプリル、スピラプリル、塩酸テモカプリル、塩酸モエキシプリル、塩酸イミダプリル、ゾフェ
- 10 ノプリルカルシウム、エナラプリラート、ゾフェノプリラート、塩酸アミロライド、塩酸ラベタロール、ニプラジロール（ニプラドロール）、リンシドミン、ケタンセリン、ピナシジル、シクレタニン（シクレタニド）、塩酸アモスラロール、塩酸モキシニジン水和物、ロサルタンカリウム、バルサルタン、メシル酸エプロサルタン、カンデサルタンシレキセチル（ヘキセチル）、イルベサルタン、テル
- 15 ミサルタン、オルメサルタンメドキシミル、メシル酸フェノルドパム、カドララジン、リン酸二水素リルメニジン、ボセンタン、ベラプロストナトリウム、リマプロストアルファデックス（ α -シクロデキストリン）、ユニプロスト（トレプロスチニルナトリウム）、イロプロスト（シロプロスト）、塩酸メカミルアミン、メテルゴリン、酢酸グアナベンズ、クロリクロメン、ファスジル、ドコネクセント
- 20 （ドコサヘキサエン酸）、シクロチアジド、クエン酸シルデナフィル、クロルダリドン、キネタゾン、インダパミド、メトラゾン、塩酸フェノキシベンザミン、メチロシン、ジアゾキシド、トラセミド（トルセミド）、クロパミド、塩酸ヒドララジン、レセルピン及びメチルドパからなる群より選択される1以上の薬剤である請求項42記載の医薬組成物。
- 25 44. 血栓症治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする請求項25記載の医薬組成物。
45. 血栓症治療薬が、ヘパリン製剤、低分子量ヘパリン、ヘパリンアナログ、抗凝固剤、トロンビン阻害剤、抗トロンビン製剤、抗血小板剤及び血栓溶解剤からなる群より選択される1以上の薬剤である請求項44記載の医薬組成物。
- 30 46. 血栓症治療薬が、ヘパリンカルシウム、ヘパリンナトリウム、ダルテパリンナトリウム、パルナパリンナトリウム、レビパリンナトリウム、ダナパロイドナトリウム、ワルファリンカリウム、アルガトロバン、メシル酸ガベキセート、

- メシル酸ナファモスタット、ヒトアンチトロンビン III、アスピリン、ジピリダモール、塩酸チクロピジン、シロスタゾール、リマプロストアルファデックス、オザグレルナトリウム、塩酸サルボグレラート、イコサペント酸エチル、ベラプロストナトリウム、ウロキナーゼ、チソキナーゼ、アルテプラザーゼ、ナサルプラザーゼ、ナテプラザーゼ、モンテプラザーゼ、パミテプラザーゼ、バトロキソビン、クエン酸ナトリウム及びプロテインCからなる群より選択される1以上の薬剤である請求項45記載の医薬組成物。
47. 高脂血症治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする請求項28記載の糖尿病予防又は治療用医薬組成物。
- 10 48. 高脂血症治療薬が、HMG-CoA レダクターゼ阻害剤(スタチン)、フィブラート、TNFSF6 発現阻害剤、HDL-コレステロール増加剤、アポ A1 発現増強剤、SPP1 (オステオポンチン) 発現阻害剤、ペルオキシソーム増殖因子活性化受容体 (PPAR) に作用する薬剤、PPAR α 作動剤、リパーゼ清澄化因子刺激剤、コレステロール拮抗剤、血小板凝固拮抗剤、抗酸化剤、コレステロール生合成阻害剤、
- 15 LDL-受容体アップレギュレーター、胆汁酸封鎖剤、コレステロール吸収阻害剤及びニコチン酸からなる群より選択される1以上の薬剤である請求項47記載の糖尿病予防又は治療用医薬組成物。
49. 高脂血症治療薬が、ロバスタチン、プラバスタチン (エプタスタチン) ナトリウム、フルバスタチン (フルインドスタイニン) ナトリウム、ロスバスタチンカルシウム、アトルバスタチンカルシウム、シンバスタチン (シンピノリン)、
- 20 ピタバスタチン (イダバスタチン、ニスバスタチン) カルシウム、ロニフィブラート (ロニフィブラート)、ビニフィブラート (ビニフィブラート)、クリノフィブラート、シプロフィブラート、クロフィブラート、エトフィブラート、フェノフィブラート、ベザフィブラート、ゲンフィブロジル、アシピモクス、エ
- 25 イコサペンタエン酸 (イコサペント、イコペネート、イコサペント酸) エチルエステル、プロブコール、ポリコサノール、塩酸コレセベラム、コレスチラミン (コレスチラミン樹脂)、塩酸コレスチポール、コレスチミド (コレスチラン)、エゼチミブ及びナイアシン (ニコチン酸) からなる群より選択される1以上の薬剤である請求項48記載の糖尿病予防又は治療用医薬組成物。
- 30 50. 他の糖尿病治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする請求項28記載の糖尿病予防又は治療用医薬組成物。
51. 他の糖尿病治療薬が、インスリン分泌促進剤、ビグアナイド剤、 α -グル

コシダーゼ阻害剤、インスリン製剤、インスリンアナログ、インスリン感受性増強剤、IL-11、抗 CD25 (IL-2 受容体) 剤、アンギオテンシン(AT1)拮抗剤、アンギオテンシン変換酵素 (ACE) 阻害剤、アルドースレダクターゼ阻害剤、抗酸化剤、カルニチンアセチルトランスフェラーゼ刺激剤、抗鬱剤、グルココルチコイド、
5 レチリン、ラジカル形成作動剤及びトランスケトラーゼ活性化剤からなる群より選択される 1 以上の薬剤である請求項 50 記載の糖尿病予防又は治療用医薬組成物。

52. 他の糖尿病治療薬が、ナテグリニド、グリメピリド、グリベンクラミド、グリクラジド、アセトヘキサミド、トルブタミド、グリクロピラミド、トラザミ
10 ド、グリブゾール、グリピジド、グルボルヌリド、グリキドン、レパグリニド、塩酸メトホルミン、塩酸ブホルミン、ボグリボース、アカルボース、エパルレスタット、ミグリトール、インスリン、塩酸ピオグリタゾン、マレイン酸ロシグリタゾン、ピコリン酸クロム/ビオチン、V-411、組換えヒトインターロイキン-11、
15 ミダプリル、 α -リボ酸、塩酸レバセカルニン(アセチル-L-カルニチン、アセチルレボカルニチン)、カプトプリル、レチリン、ベルテポルフィン、ベンフォチアミン及びフルオシノロンアセトニドからなる群より選択される 1 以上の薬剤である請求項 51 記載の糖尿病予防又は治療用医薬組成物。

53. 肥満症治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする請求項 28 記載の
20 糖尿病予防又は治療用医薬組成物。

54. 肥満症治療薬が、マジンドール、リパーゼ阻害剤、5-HT/ノルエピネフリン再取り込みデュアルインヒビター、5-HT 再取り込み阻害剤、ハーバルエフェ
ドリン及びカフェインを含むサプリメント、ヒト絨毛性性腺刺激ホルモン、アド
レナリン受容体作動剤、メタアンフェタミン、フェンタミン及びアムフェプラモ
25 ンからなる群より選択される 1 以上の薬剤である請求項 53 記載の糖尿病予防又は治療用医薬組成物。

55. 肥満症治療薬が、マジンドール、オルリスタット、塩酸シブトラミン一水和物、塩酸フルオキセチン、絨毛性性腺刺激ホルモン (ヒト)、NCP システムを用いる VNS 療法、メタラミノール、塩酸 d-メタアンフェタミン、フェンテルミ
30 ン、塩酸アムフェプラモン(ジエチルプロピオン)、塩酸ベンズフェタミン及び酒石酸フェンジメトラジンからなる群より選択される 1 以上の薬剤である請求項 54 記載の糖尿病予防又は治療用医薬組成物。

5 6. 高血圧症治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする請求項 2 8 記載の糖尿病予防又は治療用医薬組成物。

- 5 7. 高血圧症治療薬が、チアジド、アルドステロン拮抗剤、アドレナリン作動性ニューロン遮断薬、カルシウムチャネル遮断薬、ドーパミン D2 拮抗剤、 β -アドレナリン受容体拮抗剤、 α 2-アドレナリン受容体作動剤、グアニル酸シクラーゼ活性化剤、 β 1-アドレナリン受容体拮抗剤、 α 1-アドレナリン受容体拮抗剤、抗酸化剤、アンギオテンシン-I 変換酵素 (ACE) 阻害剤、 Na^+/H^+ 交換阻害剤、 α -アドレナリン受容体拮抗剤、酸化窒素供与体、5-HT₂ 拮抗剤、K(ATP)チャネル活性化剤、カリウム保持性利尿性プロスタグランジンシンターゼ刺激剤、イミダゾリン I₁ 受容体作動剤、アンギオテンシン AT₁ 拮抗剤、ドーパミン D₁ 作動剤、グアニル酸シクラーゼ刺激剤、エンドセリン ETA 受容体拮抗剤、エンドセリン ETB 受容体拮抗剤、NOS3 発現増強剤、プロスタサイクリンアナログ、プロスタグランジン、アンギオテンシン II 拮抗剤、電解質吸収作動剤、ニコチン拮抗剤、ドーパミン D₂ 作動剤、プロラクチン阻害剤、血小板活性化因子 (PAF) 拮抗剤、血小板凝固拮抗剤、腫瘍壊死因子拮抗剤、Rho キナーゼ阻害剤、PPAR α 作動剤、AMPA 受容体調節剤、GABA (A) 受容体拮抗剤及びホスホジエステラーゼ V (PDE5A) 阻害剤からなる群より選択される 1 以上の薬剤である請求項 5 6 記載の糖尿病予防又は治療用医薬組成物。

- 5 8. 高血圧症治療薬が、クロロチアジド、ヒドロクロロチアジド、ヒドロフルメチアジド、メチクロロチアジド、ポリチアジド、サイパミド、シクロベンチアジド、ベンドロフルメチアジド (ベンドロフルアジド)、スピロノラクトン、エポキシメクスレノン (エプレレノン)、モノ硫酸グアナチジン、硫酸グアナドレル、ベラパミル、塩酸プロプラノロール、塩酸アルプレノロール、ピンドロール、塩酸オクスプレノロール、マレイン酸チモロール、塩酸ソタロール、塩酸アセブトロール、塩酸カルテオロール、硫酸メピンドロール、塩酸アロチノロール、塩酸インデノロール、塩酸タータトロール、塩酸セリプロロール、塩酸チリソロール、ネビボロール、硫酸ペンブトロール、ナドロール、塩酸クロラノロール、塩酸ベバントロール (ベバントロール)、クロニジン、塩酸グアンファシン、塩酸ジルチアゼム、塩酸ニカルジピン、ニトレンジピン、フェロジピン、ニルバジピン、ニバジピン、ニソルジピン、塩酸ベニジピン、ベシル酸アムロジピン、塩酸フラニジピン (マニジピン)、ラシジピン、イスラジピン、塩酸バルニジピン (メピロジピン)、塩酸エホニジピン エタノール、シナルジピン (シルニジピン)、アラ

- ニジピン、塩酸レルカニジピン（マスニジピン）、アゼルニジピン、アムロジピン、マニジピン（フラニジピン）、ニトロプルシドナトリウム、アテノロール、酒石酸メトプロロール、塩酸ベタキソロール、ボピンドロール、フマル酸ビソプロロール、塩酸エスモロール、カルベジロール、コハク酸メトプロロール、タリ
- 5 ノロール、塩酸プラゾシン、ウラピジル、塩酸インドラミン、塩酸ブナゾシン、塩酸テラゾシン、メシル酸ドキサゾシン、ウラピジル、ニフェジピン、カプトプリル、マレイン酸エナラプリル、リシノプリル、ペリンドプリル、アラセプリル、ラミプリル、塩酸キナプリル、塩酸デラプリル、塩酸ベナゼプリル、シラザプリル、フォシノプリラート、フォシノプリルナトリウム、トランドラプリル、スピ
- 10 ラプリル、塩酸テモカプリル、塩酸モエキシプリル、塩酸イミダプリル、ゾフェノプリルカルシウム、エナラプリラート、ゾフェノプリラート、塩酸アミロライド、塩酸ラベタロール、ニプラジロール（ニプラドロール）、リンシドミン、ケタンセリン、ピナシジル、シクレタニン（シクレタニド）、塩酸アモスラロール、塩酸モキシニジン水和物、ロサルタンカリウム、バルサルタン、メシル酸エプロ
- 15 サルタン、カンデサルタンシレキセチル（ヘキセチル）、イルベサルタン、テルミサルタン、オルメサルタンメドキシミル、メシル酸フェノルドパム、カドララジン、リン酸二水素リルメニジン、ボセンタン、ベラプロストナトリウム、リマプロストアルファデックス（ α -シクロデキストリン）、ユニプロスト（トレプロスチニルナトリウム）、イロプロスト（シロプロスト）、塩酸メカミルアミン、メ
- 20 テルゴリン、酢酸グアナベンズ、クロリクロメン、ファスジル、ドコネクセント（ドコサヘキサエン酸）、シクロチアジド、クエン酸シルデナフィル、クロルタリドン、キネタゾン、インダパミド、メトラゾン、塩酸フェノキシベンザミン、メチロシン、ジアゾキシド、トラセミド（トルセミド）、クロパミド、塩酸ヒドララジン、レセルピン及びメチルドパからなる群より選択される1以上の薬剤である請求項57記載の糖尿病予防又は治療用医薬組成物。
- 25
59. 血栓症治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする請求項28記載の糖尿病予防又は治療用医薬組成物。
60. 血栓症治療薬が、ヘパリン製剤、低分子量ヘパリン、ヘパリンアナログ、抗凝固剤、トロンビン阻害剤、抗トロンビン製剤、抗血小板剤及び血栓溶解剤
- 30 からなる群より選択される1以上の薬剤である請求項59記載の糖尿病予防又は治療用医薬組成物。
61. 血栓症治療薬が、ヘパリンカルシウム、ヘパリンナトリウム、ダルテパリ

- ンナトリウム、パルナパリンナトリウム、レビパリンナトリウム、ダナパロイドナトリウム、ワルファリンカリウム、アルガトロバン、メシル酸ガベキセート、メシル酸ナファモスタット、ヒトアンチトロンビン III、アスピリン、ジピリダモール、塩酸チクロピジン、シロスタゾール、リマプロストアルファデックス、
- 5 オザグレルナトリウム、塩酸サルボグレラート、イコサペント酸エチル、ベラプロストナトリウム、ウロキナーゼ、チソキナーゼ、アルテプララーゼ、ナサルプララーゼ、ナテプララーゼ、モンテプララーゼ、パミテプララーゼ、バトロキシビン、クエン酸ナトリウム及びプロテインCからなる群より選択される1以上の薬剤である請求項60記載の糖尿病予防又は治療用医薬組成物。
- 10 62. 他の高脂血症治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする請求項29記載の高脂血症予防又は治療用医薬組成物。
63. 他の高脂血症治療薬が、HMG-CoA レダクターゼ阻害剤(スタチン)、フィブラート、TNFSF6 発現阻害剤、HDL-コレステロール増加剤、アポ A1 発現増強剤、SPP1 (オステオポンチン) 発現阻害剤、ペルオキシソーム増殖因子活性化受容体
- 15 (PPAR) に作用する薬剤、PPAR α 作動剤、リパーゼ清澄化因子刺激剤、コレステロール拮抗剤、血小板凝固拮抗剤、抗酸化剤、コレステロール生合成阻害剤、LDL-受容体アップレギュレーター、胆汁酸封鎖剤、コレステロール吸収阻害剤及びニコチン酸からなる群より選択される1以上の薬剤である請求項62記載の高脂血症予防又は治療用医薬組成物。
- 20 64. 他の高脂血症治療薬が、ロバスタチン、プラバスタチン (エプタスタチン) ナトリウム、フルバスタチン (フルインドスダイニン) ナトリウム、ロスバスタチンカルシウム、アトルバスタチンカルシウム、シンバスタチン (シンピノリン)、ピタバスタチン (イタバスタチン、ニスバスタチン) カルシウム、ロニフィブラート (ロニフィブラート)、ビニフィブラート (ビニフィブラート)、ク
- 25 リノフィブラート、シプロフィブラート、クロフィブラート、エトフィブラート、フェノフィブラート、ベザフィブラート、ゲンフィプロジル、アシピモクス、エイコサペンタエン酸 (イコサペント、イコペネート、イコサペント酸) エチルエステル、プロブコール、ポリコサノール、塩酸コレセベラム、コレステラミン (コレステラミン樹脂)、塩酸コレステポール、コレステミド (コレステラン)、
- 30 エゼチミブ及びナイアシン (ニコチン酸) からなる群より選択される1以上の薬剤である請求項63記載の高脂血症予防又は治療用医薬組成物。
65. 糖尿病治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする請求項29記載の

高脂血症予防又は治療用医薬組成物。

66. 糖尿病治療薬が、インスリン分泌促進剤、ビグアナイド剤、 α -グルコシダーゼ阻害剤、インスリン製剤、インスリンアナログ、インスリン感受性増強剤、IL-11、抗 CD25 (IL-2 受容体) 剤、アンギオテンシン(AT1)拮抗剤、アンギオテンシン変換酵素 (ACE) 阻害剤、アルドースレダクターゼ阻害剤、抗酸化剤、カルニチンアセチルトランスフェラーゼ刺激剤、抗鬱剤、グルココルチコイド、レチリン、ラジカル形成作動剤及びトランスケトラーゼ活性化剤からなる群より選択される1以上の薬剤である請求項65記載の高脂血症予防又は治療用医薬組成物。

67. 糖尿病治療薬が、ナテグリニド、グリメピリド、グリベンクラミド、グリクラジド、アセトヘキサミド、トルブタミド、グリクロピラミド、トラザミド、グリブゾール、グリピジド、グルボルヌリド、グリキドン、レパグリニド、塩酸メトホルミン、塩酸ブホルミン、ボグリボース、アカルボース、エパルレスタット、ミグリトール、インスリン、塩酸ピオグリタゾン、マレイン酸ロシグリタゾン、ピコリン酸クロム/ビオチン、V-411、組換えヒトインターロイキン-11、ダシリキシマブ (ダシリツマブ)、ロサルタンカリウム、カプトプリル、塩酸イミダプリル、 α -リボ酸、塩酸レバセカルニン(アセチル-L-カルニチン、アセチルレボカルニチン)、カプトプリル、レチリン、ベルテポルフィン、ベンフォチアミン及びフルオシノロンアセトニドからなる群より選択される1以上の薬剤である請求項66記載の高脂血症予防又は治療用医薬組成物。

68. 肥満症治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする請求項29記載の高脂血症予防又は治療用医薬組成物。

69. 肥満症治療薬が、マジンドール、リパーゼ阻害剤、5-HT/ノルエピネフリン再取り込みデュアルインヒビター、5-HT 再取り込み阻害剤、ハーバルエフェドリン及びカフェインを含むサプリメント、ヒト絨毛性性腺刺激ホルモン、アドレナリン受容体作動剤、メタアンフェタミン、フェンタミン及びアムフェプラモンからなる群より選択される1以上の薬剤である請求項68記載の高脂血症予防又は治療用医薬組成物。

70. 肥満症治療薬が、マジンドール、オルリスタット、塩酸シブトラミン-水和物、塩酸フルオキセチン、絨毛性性腺刺激ホルモン (ヒト)、NCP システムを用いる VNS 療法、メタラミノール、塩酸 d-メタアンフェタミン、フェンテルミン、塩酸アムフェプラモン(ジエチルプロピオン)、塩酸ベンズフェタミン及び酒石酸フェンジメトラジンからなる群より選択される1以上の薬剤である請求項6

9 記載の高脂血症予防又は治療用医薬組成物。

7 1. 高血圧症治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする請求項 2 9 記載の高脂血症予防又は治療用医薬組成物。

- 7 2. 高血圧症治療薬が、チアジド、アルドステロン拮抗剤、アドレナリン作動性ニューロン遮断薬、カルシウムチャネル遮断薬、ドーパミン D2 拮抗剤、 β -アドレナリン受容体拮抗剤、 $\alpha 2$ -アドレナリン受容体作動剤、グアニル酸シクラーゼ活性化剤、 $\beta 1$ -アドレナリン受容体拮抗剤、 $\alpha 1$ -アドレナリン受容体拮抗剤、抗酸化剤、アンギオテンシン-I 変換酵素 (ACE) 阻害剤、 Na^+/H^+ 交換阻害剤、 α -アドレナリン受容体拮抗剤、酸化窒素供与体、5-HT₂ 拮抗剤、K(ATP) チャネル活性化剤、カリウム保持性利尿性プロスタグランジンシンターゼ刺激剤、イミダゾリン I₁ 受容体作動剤、アンギオテンシン AT₁ 拮抗剤、ドーパミン D₁ 作動剤、グアニル酸シクラーゼ刺激剤、エンドセリン ETA 受容体拮抗剤、エンドセリン ETB 受容体拮抗剤、NOS₃ 発現増強剤、プロスタサイクリンアナログ、プロスタグランジン、アンギオテンシン II 拮抗剤、電解質吸収作動剤、ニコチン拮抗剤、ドーパミン D₂ 作動剤、プロラクチン阻害剤、血小板活性化因子 (PAF) 拮抗剤、血小板凝固拮抗剤、腫瘍壊死因子拮抗剤、Rho キナーゼ阻害剤、PPAR α 作動剤、AMPA 受容体調節剤、GABA (A) 受容体拮抗剤及びホスホジエステラーゼ V (PDE5A) 阻害剤からなる群より選択される 1 以上の薬剤である請求項 7 1 記載の高脂血症予防又は治療用医薬組成物。
- 7 3. 高血圧症治療薬が、クロロチアジド、ヒドロクロロチアジド、ヒドロフルメチアジド、メチクロロチアジド、ポリチアジド、サイパミド、シクロペンチアジド、ベンドロフルメチアジド (ベンドロフルアジド)、スピロラクトン、エポキシメクスレノン (エプレレノン)、モノ硫酸グアナチジン、硫酸グアナドレル、ベラパミル、塩酸プロプラノロール、塩酸アルプレノロール、ピンドロール、塩酸オクスプレノロール、マレイン酸チモロール、塩酸ソタロール、塩酸アセプトロール、塩酸カルテオロール、硫酸メピンドロール、塩酸アロチノロール、塩酸インデノロール、塩酸タータトロール、塩酸セリプロロール、塩酸チリソロール、ネビボロール、硫酸ペンブトロール、ナドロール、塩酸クロラノロール、塩酸ベバントール (ベバントロール)、クロニジン、塩酸グアンファシン、塩酸ジルチアゼム、塩酸ニカルジピン、ニトレンジピン、フェロジピン、ニルバジピン、ニバジピン、ニソルジピン、塩酸ベニジピン、ベシル酸アムロジピン、塩酸フラニジピン (マニジピン)、ラシジピン、イスラジピン、塩酸バルニジピン (メピロ

- ジピン)、塩酸エホニジピン エタノール、シナルジピン (シルニジピン)、アラニジピン、塩酸レルカニジピン (マスニジピン)、アゼルニジピン、アムロジピン、マニジピン (フラニジピン)、ニトロプルシドナトリウム、アテノロール、酒石酸メトプロロール、塩酸ベタキシロール、ボピンドロール、フマル酸ビソプロロール、塩酸エスモロール、カルベジロール、コハク酸メトプロロール、タリノロール、塩酸プラゾシン、ウラピジル、塩酸インドラミン、塩酸ブナゾシン、塩酸テラゾシン、メシル酸ドキサゾシン、ウラピジル、ニフェジピン、カプトプリル、マレイン酸エナラプリル、リシノプリル、ペリンドプリル、アラセプリル、ラミプリル、塩酸キナプリル、塩酸デラプリル、塩酸ベナゼプリル、シラザプリル、
- 10 フォシノプリラート、フォシノプリルナトリウム、トランドラプリル、スピラプリル、塩酸テモカプリル、塩酸モエキシプリル、塩酸イミダプリル、ゾフェノプリルカルシウム、エナラプリラート、ゾフェノプリラート、塩酸アミロライド、塩酸ラベタロール、ニブラジロール (ニブラドロール)、リンシドミン、ケタンセリン、ピナシジル、シクレタニン (シクレタニド)、塩酸アモスラロール、
- 15 塩酸モキシニジン水和物、ロサルタンカリウム、バルサルタン、メシル酸エプロサルタン、カンデサルタンシレキセチル (ヘキセチル)、イルベサルタン、テルミサルタン、オルメサルタンメドキシミル、メシル酸フェノルドパム、カドララジン、リン酸二水素リルメニジン、ボセンタン、ベラプロストナトリウム、リマプロストアルファデックス (α -シクロデキストリン)、ユニプロスト (トレプロ
- 20 スチニルナトリウム)、イロプロスト (シロプロスト)、塩酸メカミルアミン、メテルゴリン、酢酸グアナベンズ、クロリクロメン、フェスジル、ドコネクセント (ドコサヘキサエン酸)、シクロチアジド、クエン酸シルデナフィル、クロルタリドン、キネタゾン、インダパミド、メトラゾン、塩酸フェノキシベンザミン、メチロシン、ジアゾキシド、トラセミド (トルセミド)、クロバミド、塩酸ヒドラ
- 25 ラジン、レセルピン及びメチルドパからなる群より選択される 1 以上の薬剤である請求項 7 2 記載の高脂血症予防又は治療用医薬組成物。

7 4. 血栓症治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする請求項 2 9 記載の高脂血症予防又は治療用医薬組成物。

- 7 5. 血栓症治療薬が、ヘパリン製剤、低分子量ヘパリン、ヘパリンアナログ、
- 30 抗凝固剤、トロンビン阻害剤、抗トロンビン製剤、抗血小板剤及び血栓溶解剤からなる群より選択される 1 以上の薬剤である請求項 7 4 記載の高脂血症予防又は治療用医薬組成物。

76. 血栓症治療薬が、ヘパリンカルシウム、ヘパリンナトリウム、ダルテパリンナトリウム、パルナパリンナトリウム、レビパリンナトリウム、ダナパロイドナトリウム、ワルファリンカリウム、アルガトロバン、メシル酸ガベキセート、メシル酸ナファモスタット、ヒトアンチトロンビン III、アスピリン、ジピリダ
- 5 モール、塩酸チクロピジン、シロスタゾール、リマプロストアルファデックス、オザグレルナトリウム、塩酸サルボグレラート、イコサペント酸エチル、ペラプロストナトリウム、ウロキナーゼ、チソキナーゼ、アルテプララーゼ、ナサルプララーゼ、ナテプララーゼ、モンテプララーゼ、パミテプララーゼ、バトロキソビン、クエン酸ナトリウム及びプロテインCからなる群より選択される1以上の薬剤である
- 10 請求項75記載の高脂血症予防又は治療用医薬組成物。
77. 高脂血症治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする請求項30記載の肥満症予防又は治療用医薬組成物。
78. 高脂血症治療薬が、HMG-CoA レダクターゼ阻害剤(スタチン)、フィブラート、TNFSF6 発現阻害剤、HDL-コレステロール増加剤、アポ A1 発現増強剤、SPP1
- 15 (オステオポンチン) 発現阻害剤、ペルオキシソーム増殖因子活性化受容体 (PPAR) に作用する薬剤、PPAR α 作動剤、リパーゼ清澄化因子刺激剤、コレステロール拮抗剤、血小板凝固拮抗剤、抗酸化剤、コレステロール生合成阻害剤、LDL-受容体アップレギュレーター、胆汁酸封鎖剤、コレステロール吸収阻害剤及びニコチン酸からなる群より選択される1以上の薬剤である請求項77記載の肥
- 20 満症予防又は治療用医薬組成物。
79. 高脂血症治療薬が、ロバスタチン、プラバスタチン (エバスタチン) ナトリウム、フルバスタチン (フルインドスタイニン) ナトリウム、ロスバスタチンカルシウム、アトルバスタチンカルシウム、シンバスタチン (シンピノリン)、ピタバスタチン (イタバスタチン、ニスバスタチン) カルシウム、ロニフィブ
- 25 ラート (ロニフィブラート)、ビニフィブラート (ビニフィブラート)、クリノフィブラート、シプロフィブラート、クロフィブラート、エトフィブラート、フェノフィブラート、ベザフィブラート、ゲンフィプロジル、アシピモクス、エイコサペンタエン酸 (イコサペント、イコペネート、イコサペント酸) エチルエステル、プロブコール、ポリコサノール、塩酸コレセペラム、コレスチラミン
- 30 (コレスチラミン樹脂)、塩酸コレスチポール、コレスチミド (コレスチラン)、エゼチミブ及びナイアシン (ニコチン酸) からなる群より選択される1以上の薬剤である請求項78記載の肥満症予防又は治療用医薬組成物。

80. 糖尿病治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする請求項30記載の肥満症予防又は治療用医薬組成物。

81. 糖尿病治療薬が、インスリン分泌促進剤、ビッグアニド剤、 α -グルコシダーゼ阻害剤、インスリン製剤、インスリンアナログ、インスリン感受性増強剤、
5 IL-11、抗 CD25 (IL-2 受容体) 剤、アンギオテンシン(AT1)拮抗剤、アンギオテンシン変換酵素 (ACE) 阻害剤、アルドースレダクターゼ阻害剤、抗酸化剤、カルニチンアセチルトランスフェラーゼ刺激剤、抗鬱剤、グルココルチコイド、レチリン、ラジカル形成作動剤及びトランスケトラーゼ活性化剤からなる群より選択される1以上の薬剤である請求項80記載の肥満症予防又は治療用医薬組成物。
- 10 82. 糖尿病治療薬が、ナテグリニド、グリメピリド、グリベンクラミド、グリクラジド、アセトヘキサミド、トルブタミド、グリクロピラミド、トラザミド、グリブゾール、グリピジド、グルボルスリド、グリキドン、レパグリニド、塩酸メトホルミン、塩酸ブホルミン、ボグリボース、アカルボース、エパルレストット、ミグリトール、インスリン、塩酸ピオグリタゾン、マレイン酸ロシグリタゾン、
15 ピコリン酸クロム/ビオチン、V-411、組換えヒトインターロイキン-11、ダシリキシマブ (ダシリツマブ)、ロサルタンカリウム、カプトプリル、塩酸イミダプリル、 α -リポ酸、塩酸レバセカルニン (アセチル-L-カルニチン、アセチルレボカルニチン)、カプトプリル、レチリン、ベルテポルフィン、ベンフォチアミン及びフルオシノロンアセトニドからなる群より選択される1以上の薬剤である請求項81記載の肥満症予防又は治療用医薬組成物。
- 20

83. 他の肥満症治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする請求項30記載の肥満症予防又は治療用医薬組成物。

84. 他の肥満症治療薬が、マジンドール、リパーゼ阻害剤、5-HT/ノルエピネフリン再取り込みデュアルインヒビター、5-HT 再取り込み阻害剤、ハーバルエ
25 フェドリン及びカフェインを含むサプリメント、ヒト絨毛性性腺刺激ホルモン、アドレナリン受容体作動剤、メタアンフェタミン、フェンタミン及びアムフェプラモンからなる群より選択される1以上の薬剤である請求項83記載の肥満症予防又は治療用医薬組成物。

85. 他の肥満症治療薬が、マジンドール、オルリスタット、塩酸シブトラミン
30 一水和物、塩酸フルオキセチン、絨毛性性腺刺激ホルモン (ヒト)、NCP システムを用いる VNS 療法、メタラミノール、塩酸 d-メタアンフェタミン、フェンテルミン、塩酸アムフェプラモン (ジエチルプロピオン)、塩酸ベンズフェタミン及

び酒石酸フェンジメトラジンからなる群より選択される 1 以上の薬剤である請求項 8 4 記載の肥満症予防又は治療用医薬組成物。

8 6. 高血圧症治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする請求項 3 0 記載の肥満症予防又は治療用医薬組成物。

- 5 8 7. 高血圧症治療薬が、チアジド、アルドステロン拮抗剤、アドレナリン作動性ニューロン遮断薬、カルシウムチャネル遮断薬、ドーパミン D2 拮抗剤、 β -アドレナリン受容体拮抗剤、 α 2-アドレナリン受容体作動剤、グアニル酸シクラーゼ活性化剤、 β 1-アドレナリン受容体拮抗剤、 α 1-アドレナリン受容体拮抗剤、抗酸化剤、アンギオテンシン-I 変換酵素 (ACE) 阻害剤、 Na^+/H^+ 交換阻害剤、 α -
- 10 アドレナリン受容体拮抗剤、酸化窒素供与体、5-HT2 拮抗剤、K(ATP)チャネル活性化剤、カリウム保持性利尿性プロスタグランジンシンターゼ刺激剤、イミダゾリン I1 受容体作動剤、アンギオテンシン AT1 拮抗剤、ドーパミン D1 作動剤、グアニル酸シクラーゼ刺激剤、エンドセリン ETA 受容体拮抗剤、エンドセリン ETB 受容体拮抗剤、NOS3 発現増強剤、プロスタサイクリンアナログ、プロスタグラ
- 15 ンジン、アンギオテンシン II 拮抗剤、電解質吸収作動剤、ニコチン拮抗剤、ドーパミン D2 作動剤、プロラクチン阻害剤、血小板活性化因子 (PAF) 拮抗剤、血小板凝固拮抗剤、腫瘍壊死因子拮抗剤、Rho キナーゼ阻害剤、PPAR α 作動剤、AMPA 受容体調節剤、GABA (A) 受容体拮抗剤及びホスホジエステラーゼ V (PDE5A) 阻害剤からなる群より選択される 1 以上の薬剤である請求項 8 6 記載の肥満症予
- 20 防又は治療用医薬組成物。

- 8 8. 高血圧症治療薬が、クロロチアジド、ヒドロクロロチアジド、ヒドロフルメチアジド、メチクロロチアジド、ポリチアジド、サイパミド、シクロペンチアジド、ベンドロフルメチアジド (ベンドロフルアジド)、スピロノラクトン、エポキシメクスレノン (エブレレノン)、モノ硫酸グアナチジン、硫酸グアナドレル、
- 25 ベラパミル、塩酸プロプラノロール、塩酸アルプレノロール、ピンドロール、塩酸オクスプレノロール、マレイン酸チモロール、塩酸ソタロール、塩酸アセブトロール、塩酸カルテオロール、硫酸メピンドロール、塩酸アロチノロール、塩酸インデノロール、塩酸タータトロール、塩酸セリプロロール、塩酸チリソロール、ネビボロール、硫酸ペンブトロール、ナドロール、塩酸クロラノロール、塩酸ベ
- 30 パントール (ベバントロール)、クロニジン、塩酸グアンファシン、塩酸ジルチアゼム、塩酸ニカルジピン、ニトレンジピン、フェロジピン、ニルバジピン、ニバジピン、ニソルジピン、塩酸ベニジピン、ベシル酸アムロジピン、塩酸フラニ

- ジピン (マニジピン)、ラシジピン、イスラジピン、塩酸バルニジピン (メピロジピン)、塩酸エホニジピン エタノール、シナルジピン (シルニジピン)、アラニジピン、塩酸レルカニジピン (マスニジピン)、アゼルニジピン、アムロジピン、マニジピン (フラニジピン)、ニトロプルシドナトリウム、アテノロール、
- 5 酒石酸メトプロロール、塩酸ベタキソロール、ボピンドロール、フマル酸ビソプロロール、塩酸エスモロール、カルベジロール、コハク酸メトプロロール、タリノロール、塩酸プラゾシン、ウラピジル、塩酸インドラミン、塩酸ブナゾシン、塩酸テラゾシン、メシル酸ドキサゾシン、ウラピジル、ニフェジピン、カプトプリル、マレイン酸エナラプリル、リシノプリル、ペリンドプリル、アラセプリル、
- 10 ラミプリル、塩酸キナプリル、塩酸デラプリル、塩酸ベナゼプリル、シラザプリル、フォシノプリラート、フォシノプリルナトリウム、トランドラプリル、スピラプリル、塩酸デモカプリル、塩酸モエキシプリル、塩酸イミダプリル、ゾフェノプリルカルシウム、エナラプリラート、ゾフェノプリラート、塩酸アミロライド、塩酸ラベタロール、ニブラジロール (ニブラドロール)、リンシドミン、ケ
- 15 タンセリン、ピナシジル、シクレタニン (シクレタニド)、塩酸アモスラロール、塩酸モキシニジン水和物、ロサルタンカリウム、バルサルタン、メシル酸エプロサルタン、カンデサルタンシレキセチル (ヘキセチル)、イルベサルタン、テルミサルタン、オルメサルタンメドキシミル、メシル酸フェノルドパム、カドララジン、リン酸二水素リルメニジン、ボセンタン、ベラプロストナトリウム、リマ
- 20 プロストアルファデックス (α -シクロデキストリン)、ユニプロスト (トレプロスチニルナトリウム)、イロプロスト (シロプロスト)、塩酸メカミルアミン、メテルゴリン、酢酸グアナベンズ、クロリクロメン、ファスジル、ドコネクセント (ドコサヘキサエン酸)、シクロチアジド、クエン酸シルデナフィル、クロルタリドン、キネタゾン、インダパミド、メトラゾン、塩酸フェノキシベンザミン、メ
- 25 チロシン、ジアゾキシド、トラセミド (トルセミド)、クロパミド、塩酸ヒドララジン、レセルピン及びメチルドパからなる群より選択される 1 以上の薬剤である請求項 8 7 記載の肥満症予防又は治療用医薬組成物。

8 9. 血栓症治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする請求項 3 0 記載の肥満症予防又は治療用医薬組成物。

- 30 9 0. 血栓症治療薬が、ヘパリン製剤、低分子量ヘパリン、ヘパリンアナログ、抗凝固剤、トロンビン阻害剤、抗トロンビン製剤、抗血小板剤及び血栓溶解剤からなる群より選択される 1 以上の薬剤である請求項 8 9 記載の肥満症予防又は治

療用医薬組成物。

- 9 1. 血栓症治療薬が、ヘパリンカルシウム、ヘパリンナトリウム、ダルテパリンナトリウム、パルナパリンナトリウム、レビパリンナトリウム、ダナパロイドナトリウム、ワルファリンカリウム、アルガトロバン、メシル酸ガベキセート、
- 5 メシル酸ナファモスタット、ヒトアンチトロンビン III、アスピリン、ジピリダモール、塩酸チクロピジン、シロスタゾール、リマプロストアルファデックス、オザグレルナトリウム、塩酸サルボグレラート、イコサペント酸エチル、ベラプロストナトリウム、ウロキナーゼ、チソキナーゼ、アルテプララーゼ、ナサルプララーゼ、ナテプララーゼ、モンテプララーゼ、パミテプララーゼ、バトロキソビン、ク
- 10 エン酸ナトリウム及びプロテインCからなる群より選択される1以上の薬剤である請求項90記載の肥満症予防又は治療用医薬組成物。
- 9 2. 高脂血症治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする請求項31記載の糖尿病合併症予防又は治療用医薬組成物。
- 9 3. 高脂血症治療薬が、HMG-CoA レダクターゼ阻害剤(スタチン)、フィブラー
- 15 ト、TNFSF6 発現阻害剤、HDL-コレステロール増加剤、アポ A1 発現増強剤、SPP1 (オステオポンチン) 発現阻害剤、ペルオキシソーム増殖因子活性化受容体 (PPAR) に作用する薬剤、PPAR α 作動剤、リパーゼ清澄化因子刺激剤、コレステロール拮抗剤、血小板凝固拮抗剤、抗酸化剤、コレステロール生合成阻害剤、LDL-受容体アップレギュレーター、胆汁酸封鎖剤、コレステロール吸収阻害剤及
- 20 びニコチン酸からなる群より選択される1以上の薬剤である請求項92記載の糖尿病合併症予防又は治療用医薬組成物。
- 9 4. 高脂血症治療薬が、ロバスタチン、プラバスタチン (エプタスタチン) ナトリウム、フルバスタチン (フルインドスタイニン) ナトリウム、ロスバスタチンカルシウム、アトルバスタチンカルシウム、シンバスタチン (シンビノリン)、
- 25 ピタバスタチン (イタバスタチン、ニスバスタチン) カルシウム、ロニフィブラート (ロニフィブラート)、ビニフィブラート (ビニフィブラート)、クリノフィブラート、シプロフィブラート、クロフィブラート、エトフィブラート、フェノフィブラート、ベザフィブラート、ゲンフィブロジル、アシピモクス、エイコサペンタエン酸 (イコサペント、イコペネート、イコサペント酸) エチルエ
- 30 ステル、プロブコール、ポリコサノール、塩酸コレセベラム、コレスチラミン (コレスチラミン樹脂)、塩酸コレスチポール、コレスチミド (コレスチラン)、エゼチミブ及びナイアシン (ニコチン酸) からなる群より選択される1以上の薬

剤である請求項 9 3 記載の糖尿病合併症予防又は治療用医薬組成物。

9 5. 糖尿病治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする請求項 3 1 記載の糖尿病合併症予防又は治療用医薬組成物。

9 6. 糖尿病治療薬が、インスリン分泌促進剤、ビッグアニド剤、 α -グルコシダーゼ阻害剤、インスリン製剤、インスリンアナログ、インスリン感受性増強剤、IL-11、抗 CD25 (IL-2 受容体) 剤、アンギオテンシン(AT1)拮抗剤、アンギオテンシン変換酵素 (ACE)阻害剤、アルドースレダクターゼ阻害剤、抗酸化剤、カルニチンアセチルトランスフェラーゼ刺激剤、抗鬱剤、グルココルチコイド、レチリン、ラジカル形成作動剤及びトランスケトラーゼ活性化剤からなる群より選択される 1 以上の薬剤である請求項 9 5 記載の糖尿病合併症予防又は治療用医薬組成物。

9 7. 糖尿病治療薬が、ナテグリニド、グリメピリド、グリベンクラミド、グリクラジド、アセトヘキサミド、トルブタミド、グリクロピラミド、トラザミド、グリブゾール、グリピジド、グルボルヌリド、グリキドン、レパグリニド、塩酸メトホルミン、塩酸ブホルミン、ボグリボース、アカルボース、エパールレスタット、ミグリトール、インスリン、塩酸ピオグリタゾン、マレイン酸ロシグリタゾン、ピコリン酸クロム/ビオチン、V-411、組換えヒトインターロイキン-11、ダシリキシマブ (ダシリツマブ)、ロサルタンカリウム、カプトプリル、塩酸イミダプリル、 α -リポ酸、塩酸レバセカルニン(アセチル-L-カルニチン、アセチルレボカルニチン)、カプトプリル、レチリン、ベルテポルフィン、ペンフォチアミン及びフルオシノロンアセトニドからなる群より選択される 1 以上の薬剤である請求項 9 6 記載の糖尿病合併症予防又は治療用医薬組成物。

9 8. 肥満症治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする請求項 3 1 記載の糖尿病合併症予防又は治療用医薬組成物。

9 9. 肥満症治療薬が、マジンドール、リパーゼ阻害剤、5-HT/ノルエピネフリン再取り込みデュアルインヒビター、5-HT 再取り込み阻害剤、ハーバルエフェドリン及びカフェインを含むサプリメント、ヒト絨毛性性腺刺激ホルモン、アドレナリン受容体作動剤、メタアンフェタミン、フェンタミン及びアムフェプラモンからなる群より選択される 1 以上の薬剤である請求項 9 8 記載の糖尿病合併症予防又は治療用医薬組成物。

1 0 0. 肥満症治療薬が、マジンドール、オルリスタット、塩酸シブトラミン水和物、塩酸フルオキセチン、絨毛性性腺刺激ホルモン (ヒト)、NCP システム

を用いる VNS 療法、メタラミノール、塩酸 d-メタアンフェタミン、フェンテルミン、塩酸アムフェプラモン(ジエチルプロピオン)、塩酸ベンズフェタミン及び酒石酸フェンジメトラジンからなる群より選択される 1 以上の薬剤である請求項 99 記載の糖尿病合併症予防又は治療用医薬組成物。

- 5 101. 高血圧症治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする請求項 31 記載の糖尿病合併症予防又は治療用医薬組成物。
102. 高血圧症治療薬が、チアジド、アルドステロン拮抗剤、アドレナリン作動性ニューロン遮断薬、カルシウムチャネル遮断薬、ドーパミン D2 拮抗剤、 β -アドレナリン受容体拮抗剤、 α 2-アドレナリン受容体作動剤、グアニル酸シクラーゼ活性化剤、 β 1-アドレナリン受容体拮抗剤、 α 1-アドレナリン受容体拮抗剤、抗酸化剤、アンギオテンシン-I 変換酵素 (ACE) 阻害剤、 Na^+/H^+ 交換阻害剤、 α -アドレナリン受容体拮抗剤、酸化窒素供与体、5-HT₂ 拮抗剤、K(ATP)チャネル活性化剤、カリウム保持性利尿性プロスタグランジンシンターゼ刺激剤、イミダゾリン I₁ 受容体作動剤、アンギオテンシン AT₁ 拮抗剤、ドーパミン D₁ 作動剤、
- 15 グアニル酸シクラーゼ刺激剤、エンドセリン ETA 受容体拮抗剤、エンドセリン ETB 受容体拮抗剤、NOS3 発現増強剤、プロスタサイクリンアナログ、プロスタグランジン、アンギオテンシン II 拮抗剤、電解質吸収作動剤、ニコチン拮抗剤、ドーパミン D₂ 作動剤、プロラクチン阻害剤、血小板活性化因子 (PAF) 拮抗剤、血小板凝固拮抗剤、腫瘍壊死因子拮抗剤、Rho キナーゼ阻害剤、PPAR α 作動剤、
- 20 AMPA 受容体調節剤、GABA (A) 受容体拮抗剤及びホスホジエステラーゼ V (PDE5A) 阻害剤からなる群より選択される 1 以上の薬剤である請求項 101 記載の糖尿病合併症予防又は治療用医薬組成物。
103. 高血圧症治療薬が、クロロチアジド、ヒドロクロロチアジド、ヒドロフルメチアジド、メチクロチアジド、ポリチアジド、サイパミド、シクロペンチアジド、ベンドロフルメチアジド (ベンドロフルアジド)、スピロラクトン、エ
- 25 ポキシメクスレノン (エプレレノン)、モノ硫酸グアネチジン、硫酸グアナドレル、ベラパミル、塩酸プロプラノロール、塩酸アルプレノロール、ピンドロール、塩酸オクスプレノロール、マレイン酸チモロール、塩酸ソタロール、塩酸アセプトロール、塩酸カルテオロール、硫酸メピンドロール、塩酸アロチノロール、塩
- 30 酸インデノロール、塩酸タータトロール、塩酸セリプロロール、塩酸チリソロール、ネビボロール、硫酸ペンブトロール、ナドロール、塩酸クロラノロール、塩酸ベバントール (ベバントロール)、クロニジン、塩酸グアンファシン、塩酸ジ

- ルチアゼム、塩酸ニカルジピン、ニトレンジピン、フェロジピン、ニルバジピン、ニバジピン、ニソルジピン、塩酸ベニジピン、ベシル酸アムロジピン、塩酸フラニジピン（マニジピン）、ラシジピン、イスラジピン、塩酸バルニジピン（メピロジピン）、塩酸エホニジピン エタノール、シナルジピン（シルニジピン）、アラニジピン、塩酸レルカニジピン（マスニジピン）、アゼルニジピン、アムロジピン、マニジピン（フラニジピン）、ニトロプルシドナトリウム、アテノロール、酒石酸メトプロロール、塩酸ベタキソロール、ボピンドロール、フマル酸ビソプロロール、塩酸エスモロール、カルベジロール、コハク酸メトプロロール、タリノロール、塩酸プラゾシン、ウラピジル、塩酸インドラミン、塩酸ブナゾシン、
- 10 塩酸テラゾシン、メシル酸ドキサゾシン、ウラピジル、ニフェジピン、カプトプリル、マレイン酸エナラプリル、リシノプリル、ペリンドプリル、アラセプリル、ラミプリル、塩酸キナプリル、塩酸デラプリル、塩酸ベナゼプリル、シラザプリル、フォシノプリラート、フォシノプリルナトリウム、トランドラプリル、スピラプリル、塩酸テモカプリル、塩酸モエキシプリル、塩酸イミダプリル、ゾフェ
- 15 ノプリルカルシウム、エナラプリラート、ゾフェノプリラート、塩酸アミロライド、塩酸ラベタロール、ニブラジロール（ニブラドロール）、リンシドミン、ケタンセリン、ピナシジル、シクレタニン（シクレタニド）、塩酸アモステロール、塩酸モキシニジン水和物、ロサルタンカリウム、バルサルタン、メシル酸エプロサルタン、カンデサルタンシレキセチル（ヘキセチル）、イルベサルタン、テル
- 20 ミサルタン、オルメサルタンメドキシミル、メシル酸フェノルドパム、カドラタジン、リン酸二水素リルメニジン、ボセンタン、ベラプロストナトリウム、リマプロストアルファデックス（ α -シクロデキストリン）、ユニプロスト（トレプロスチニルナトリウム）、イロプロスト（シロプロスト）、塩酸メカミルアミン、メテルゴリン、酢酸グアナベンズ、クロリクロメン、ファスジル、ドコネクセント
- 25 （ドコサヘキサエン酸）、シクロチアジド、クエン酸シルデナフィル、クロルタリドン、キネタゾン、インダパミド、メトラゾン、塩酸フェノキシベンザミン、メチロシン、ジアゾキシド、トラセミド（トルセミド）、クロパミド、塩酸ヒドララジン、レセルピン及びメチルドパからなる群より選択される1以上の薬剤である請求項102記載の糖尿病合併症予防又は治療用医薬組成物。
- 30 104. 血栓症治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする請求項31記載の糖尿病合併症予防又は治療用医薬組成物。
105. 血栓症治療薬が、ヘパリン製剤、低分子量ヘパリン、ヘパリンアナログ、

抗凝固剤、トロンビン阻害剤、抗トロンビン製剤、抗血小板剤及び血栓溶解剤からなる群より選択される1以上の薬剤である請求項104記載の糖尿病合併症予防又は治療用医薬組成物。

106. 血栓症治療薬が、ヘパリンカルシウム、ヘパリンナトリウム、ダルテパリンナトリウム、パルナパリンナトリウム、レビパリンナトリウム、ダナパロイドナトリウム、ワルファリンカリウム、アルガトロバン、メシル酸ガベキセート、メシル酸ナファモスタット、ヒトアンチトロンビン III、アスピリン、ジピリダモール、塩酸チクロピジン、シロスタゾール、リマプロストアルファデックス、オザグレルナトリウム、塩酸サルボグレラート、イコサペント酸エチル、ベラプロストナトリウム、ウロキナーゼ、チソキナーゼ、アルテプラナーゼ、ナサルプラナーゼ、ナテプラナーゼ、モンテプラナーゼ、パミテプラナーゼ、バトロキソビン、クエン酸ナトリウム及びプロテインCからなる群より選択される1以上の薬剤である請求項105記載の糖尿病合併症予防又は治療用医薬組成物。

107. 高脂血症治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする受容体型チロシンキナーゼネガティブ調節因子阻害用医薬組成物。

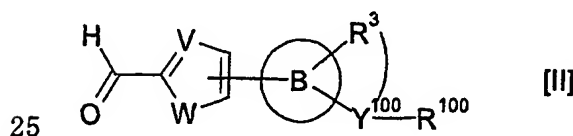
108. 糖尿病治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする受容体型チロシンキナーゼネガティブ調節因子阻害用医薬組成物。

109. 肥満症治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする受容体型チロシンキナーゼネガティブ調節因子阻害用医薬組成物。

110. 高血圧症治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする受容体型チロシンキナーゼネガティブ調節因子阻害用医薬組成物。

111. 血栓症治療薬と組み合わせて使用することを特徴とする受容体型チロシンキナーゼネガティブ調節因子阻害用医薬組成物。

112. 一般式 [I I]



[式中、

Y^{100} は $-C(R^{13})(R^{14})-$ (R^{13} 及び R^{14} は、それぞれ、請求項1に記載の通りである。)を示し；

R^{100} は、水酸基又はハロゲン原子を示し；

30 V、W及び R^3 は、それぞれ、請求項1に記載の通りである。] で示される複素芳

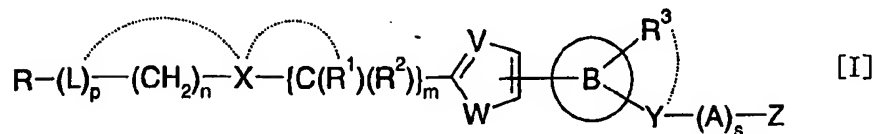
香 5 員環化合物又はその医薬上許容し得る塩。

1 1 3. 一般式 [I I] において、 R^{13} 及び R^{14} はそれぞれ水素原子を示し、
V は $=CH-$ を示し、W は $-S-$ を示す請求項 1 1 2 記載の複素芳香 5 員環化合物
物又はその医薬上許容し得る塩。

補正書の請求の範囲

【2004年9月16日（16. 09. 04）国際事務局受理：出願当初の請求の範囲
1及び2は補正された；他の請求の範囲は変更なし。（21頁）】

1.（補正後）一般式 [I]



[式中、

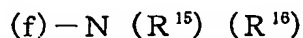
- 5 Vは=N-又は=CH-を示し；
Wは-S-又は-O-を示し；
mは0、1又は2を示し；
R¹及びR²は、それぞれ独立して、水素原子又はC₁₋₄アルキル基を示し；
Xは-N (R⁴) -、-N (R⁵) -CO-O-、-SO₂-N (R⁵) -、
10 -N (R⁵) -SO₂-、-N (R⁶) -SO₂-N (R⁵) -、-CO-N (R⁷) -、
-N (R⁸) -CO-、-N (R⁹) -CO-N (R⁵) -、
-N (R¹⁰) - (CH₂)_k-N (R⁵) -、
-N (R¹⁰) - (CH₂)_k-N (R⁵) -CO-、
-C (R¹⁰) =N-N (R⁷) -、-N (R¹⁰) - (CH₂)_k-CH (R⁶) -、
15 -O-、-S-又は-SO₂-

(式中、

- kは0又は1乃至4の整数を示し、
R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R⁹及びR¹⁰は、それぞれ独立して、
(1)水素原子、
20 (2)C₁₋₆アルキル基
(当該C₁₋₆アルキル基は
(a)置換されてもよいアリール基、
(b)置換されてもよい芳香族ヘテロ環基、
(c)カルボキシ基、
25 (d)C₁₋₄アルコキシカルボニル基、
(e)-CO-N (R¹⁵) (R¹⁶)

(式中、R¹⁵及びR¹⁶は、それぞれ独立して、水素原子、置換されてもよいアリール基、置換されてもよい芳香族ヘテロ環基、C₁₋₆アルキル基（当該C₁₋₆アルキル基は置換されてもよいアリール基、置換されてもよい芳香族ヘテロ環基、

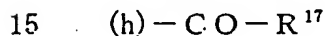
アリール基で置換されてもよい C_{1-4} アルコキシ基及び置換されてもよいアリールオキシ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい)を示すか、又はそれらが結合する窒素原子と一緒に、インドリン環を形成してもよく、若しくはさらに窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択される少なくとも1つのヘテロ原子を含有してもよい5乃至7員ヘテロ環を形成してもよい)、



(式中、 R^{15} 及び R^{16} は前記記載の通りである)、



10 (式中、 R^{17} は水素原子、置換されてもよいアリール基、置換されてもよい芳香族ヘテロ環基又は C_{1-6} アルキル基(当該 C_{1-6} アルキル基は置換されてもよいアリール基、置換されてもよい芳香族ヘテロ環基、アリール基で置換されてもよい C_{1-4} アルコキシ基及び置換されてもよいアリールオキシ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい)を示す)、

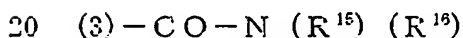


(式中、 R^{17} は前記記載の通りである)、

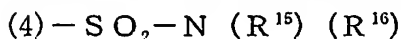


(式中、 R^{17} は前記記載の通りである)又は

(j) C_{3-7} シクロアルキル基で置換されていてもよい)、



(式中、 R^{15} 及び R^{16} は前記記載の通りである)、



(式中、 R^{15} 及び R^{16} は前記記載の通りである)、



25 (式中、 R^{17} は前記記載の通りである)、

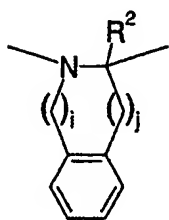


(式中、 R^{17} は前記記載の通りである)、

(7) 置換されてもよいアリール基、

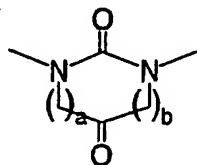
(8) 置換されてもよい芳香族ヘテロ環基を示すか、又は





(式中、 i 及び j は、それぞれ独立して、0、1 又は 2 を示し、 R^2 は前記記載の通りである) を形成してもよく、

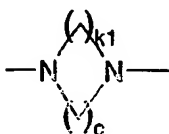
(10) R^5 及び R^9 が一緒になって



5

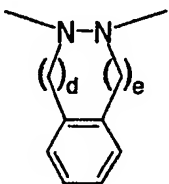
(式中、 a 及び b は、それぞれ独立して、0、1 又は 2 を示す) を形成してもよく、

(11) R^5 及び R^{10} が一緒になって



10 (式中、 $k1$ 及び c は、それぞれ独立して、0 又は 1 乃至 4 の整数を示す) を形成してもよく、

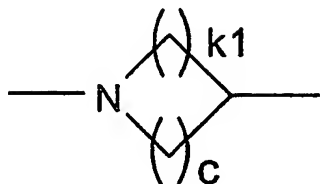
(12) R^5 及び R^{10} が一緒になって



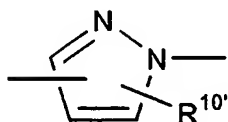
(式中、 d 及び e は、それぞれ独立して、0、1 又は 2 を示す) を形成してもよく、

15 く、

(13) R^6 及び R^{10} が一緒になって



(式中、 $k1$ 及び c は前記記載の通りである) を形成してもよく、若しくは
(14) R^7 及び R^{10} が一緒になって



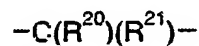
- 5 (式中、 $R^{10'}$ は水素原子又は C_{1-6} アルキル基を示す) を形成してもよい) を示し；

n は 0 又は 1 乃至 4 の整数を示し；

p は 0 又は 1 を示し；

L は

- 10 (1)



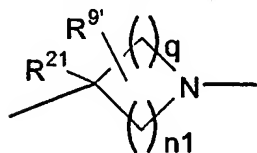
(式中、

R^{20} は

(a) 水素原子、

- 15 (b) C_{1-6} アルキル基を示すか、又は

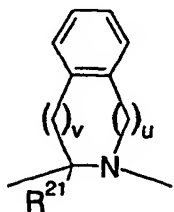
(c) R^4 又は R^8 と一緒になって



(式中、 $n1$ 及び q は、それぞれ独立して、0 又は 1 乃至 4 の整数を示し、 $R^{9'}$ は水素原子、水酸基、 C_{1-6} アルキル基、カルボキシ基又は C_{1-6} アルコキシ

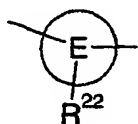
- 20 基を示す) を形成してもよく、若しくは

(d) R^4 と一緒になって



(式中、 u 及び v は、それぞれ独立して、0、1 又は 2 を示す) を形成してもよく、

- R^{21} は水素原子、 C_{1-6} アルキル基 (当該 C_{1-6} アルキル基は置換されてもよいアリール基又は置換されてもよい芳香族ヘテロ環基で置換されていてもよい)、置換されてもよいアリール基又は置換されてもよい芳香族ヘテロ環基を示す)、
- (2)



(式中、

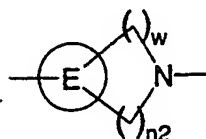
- 10 E はアリール基又は芳香族ヘテロ環基を示し、

R^{22} は

- (a) 水素原子、
- (b) ハロゲン原子、
- (c) C_{1-4} アルキル基、
- 15 (d) カルボキシ基で置換されてもよい C_{1-4} アルコキシ基、
- (e) C_{1-6} アルキルチオ基、
- (f) ニトロ基、
- (g) $-N(R^{23})(R^{24})$

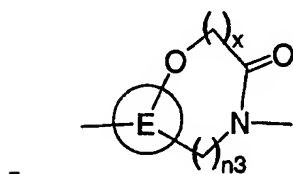
(式中、 R^{23} 及び R^{24} は、それぞれ独立して、水素原子、 C_{1-6} アルキル基、 C_{1-4}

- 20 アルキルカルボニル基 (当該 C_{1-4} アルキルカルボニル基はアミノ基、 C_{1-4} アルキルアミノ基又はジ (C_{1-4} アルキル) アミノ基で置換されていてもよい) 又は C_{1-4} アルキルスルホニル基を示す) を示すか、又は
- (h) R^4 と一緒になって



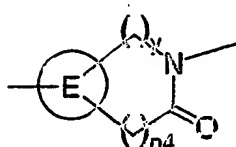
(式中、 n_2 及び w は、それぞれ独立して、0 又は 1 乃至 3 の整数を示し、E は前記記載の通りである) を形成してもよく、

(i) R^4 と一緒になって



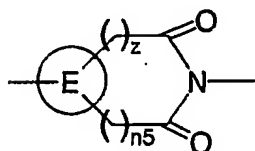
(式中、 n_3 及び x は、それぞれ独立して、0 又は 1 を示し、E は前記記載の通りである) を形成してもよく、

(j) R^7 と一緒になって



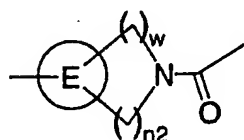
10 (式中、 n_4 及び y は、それぞれ独立して、0、1 又は 2 を示し、E は前記記載の通りである) を形成してもよく、

(k) R^7 と一緒になって



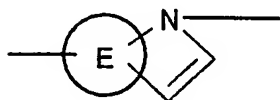
15 (式中、 n_5 及び z は、それぞれ独立して、0 又は 1 を示し、E は前記記載の通りである) を形成してもよく、

(l) R^8 と一緒になって

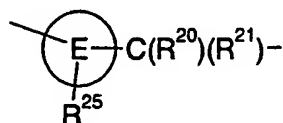


(式中、 n_2 及び w は、それぞれ独立して、0 又は 1 乃至 3 の整数を示し、 E は前記記載の通りである) を形成してもよく、若しくは

(m) R^4 と一緒になって



- 5 (式中、 E は前記記載の通りである) を形成してもよく、又は、
(3)



(式中、

R^{20} 、 R^{21} 及び E は前記記載の通りであり、

- 10 R^{25} は

- (a) 水素原子、
- (b) ハロゲン原子、
- (c) C_{1-4} アルキル基、
- (d) カルボキシ基で置換されてもよい C_{1-4} アルコキシ基、
- 15 (e) C_{1-6} アルキルチオ基、
- (f) ニトロ基又は
- (g) $-N(R^{23})(R^{24})$

(式中、 R^{23} 及び R^{24} は前記記載の通りである) を示し；

R は $-COO(R^{19})$ 、 $-A^1-COO(R^{19})$ 又は $-O-A^1-COO(R^{19})$

- 20 (式中、 A^1 は C_{1-4} アルキレン基を示し、 R^{19} は水素原子又は C_{1-4} アルキル基を示す) を示し；

B はアリール基又は芳香族ヘテロ環基を示し；

R^3 は

(1) 水素原子、

- 25 (2) ハロゲン原子、

(3) C_{1-8} アルキル基、

(4) C_{1-6} アルコキシ基、

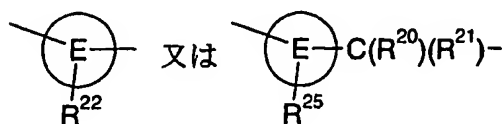
- (5) C_{1-6} アルキルアミノ基、
 - (6) ジ (C_{1-6} アルキル) アミノ基、
 - (7) シアノ基、
 - (8) ニトロ基、
 - 5 (9) C_{1-4} ハロアルキル基、
 - (10) $-S-R^{18}$ (R^{18} は C_{1-6} アルキル基又はアリール基を示す)、
 - (11) $-SO-R^{18}$ (R^{18} は C_{1-6} アルキル基又はアリール基を示す)、
 - (12) $-SO_2-R^{18}$ (R^{18} は C_{1-6} アルキル基又はアリール基を示す)、
 - (13) アリール基又は
 - 10 (14) ヘテロ環基を示し；
- Y は $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-N(R^{11})-$ 、 $-N(R^{12})-CO-$ 、 $-N(R^{12})-SO_2-$ 、 $-SO_2-N(R^{12})-$ 、 $-C(R^{13})(R^{14})-$ 、 $-CO-$ 、 $-C(R^{13})(R^{14})-N(R^{12})-$ 、 $-CO-N(R^{12})-$ 又は $-C(R^{13})(R^{14})-O-$
- 15 (式中、
 - R^{11} は
 - (1) 水素原子、
 - (2) C_{1-8} アルキル基
 - (当該 C_{1-8} アルキル基は
 - 20 (a) C_{3-7} シクロアルキル基、
 - (b) 置換されてもよいアリール基、
 - (c) 置換されてもよいヘテロ環基、
 - (d) 水酸基、
 - (e) C_{1-4} アルキルアミノ基及び
 - 25 (f) ジ (C_{1-4} アルキル) アミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい)、
 - (3) C_{2-4} アルケニル基、
 - (4) C_{1-4} アルキルスルホニル基、
 - (5) C_{1-4} アルキルカルボニル基
 - 30 (当該 C_{1-4} アルキルカルボニル基は水酸基又は C_{1-4} アルコキシ基で置換されていてもよい) を示すか、又は
 - (6) R^3 と一緒になって



(式中、 t は 1 乃至 4 の整数を示し、 B は前記記載の通りである) を形成してもよく、

R^{12} は

- 5 (1) 水素原子、
- (2) C_{1-8} アルキル基
(当該 C_{1-8} アルキル基は
 - (a) C_{3-7} シクロアルキル基、
 - (b) 置換されてもよいアリール基、
 - 10 (c) 置換されてもよいヘテロ環基、
 - (d) 水酸基、
 - (e) C_{1-4} アルキルアミノ基及び
 - (f) ジ (C_{1-4} アルキル) アミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい)、
- 15 (3) C_{2-4} アルケニル基、
- (4) C_{1-4} アルキルスルホニル基又は
- (5) C_{1-4} アルキルカルボニル基
(当該 C_{1-4} アルキルカルボニル基は水酸基又は C_{1-4} アルコキシ基で置換されていてもよい) を示し、
- 20 R^{13} 及び R^{14} は、それぞれ独立して、水素原子、 C_{1-4} アルキル基を示すか、又はそれらが結合する炭素原子と一緒になって C_{3-7} シクロアルカンを形成してもよく、若しくはそれらが結合する炭素原子と一緒になって、さらに窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択される少なくとも 1 つのヘテロ原子を含有してもよい 5 乃至 7 員ヘテロ環を形成してもよい) を示し
- 25 (但し、
 m が 0 であり、 p が 1 であり、 L が



(式中、 R^{20} 及び R^{21} はそれぞれ水素原子を示し、 E はフェニル基を示し、 R^{22} は水素原子、ハロゲン原子、 C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基又はニトロ基を示し、 R^{25} は水素原子、ハロゲン原子、 C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基又はニトロ基を示す) である場合には、

5 Yは、

$-C(R^{13})(R^{14})-N(R^{12})-$ 、 $-CO-N(R^{12})-$ 又は $-C(R^{13})(R^{14})-O-$ (式中、 R^{12} 、 R^{13} 及び R^{14} は前記記載の通りである) である)；

s は 0 又は 1 を示し；

A は C_{3-7} シクロアルキル基で置換されてもよい C_{1-4} アルキレン基を示し；

10 Zは

(1) C_{3-7} シクロアルキル基

(当該 C_{3-7} シクロアルキル基はアリール基 (当該アリール基はハロゲン原子又は C_{1-6} アルキル基で置換されてもよい) 又は芳香族ヘテロ環基 (当該芳香族ヘテロ環基はハロゲン原子又は C_{1-6} アルキル基で置換されてもよい) で置換されていてもよい)、

15

(2) アリール基

(当該アリール基は

(a) C_{1-4} アルキル基又は C_{1-4} アルキルカルボニル基で置換されてもよいヘテロ環基、

20 (b) 水酸基、オキソ基、ハロゲン原子又は C_{1-6} アルキル基で置換されてもよい C_{3-7} シクロアルキル基、

(c) カルボキシ基、

(d) ハロゲン原子、

(e) C_{1-8} アルキル基、

25 (f) C_{1-4} ハロアルキル基、

(g) C_{1-4} アルキルアミノ基、

(h) ジ (C_{1-4} アルキル) アミノ基、

(i) C_{1-6} アルキルチオ基、

(j) C_{1-4} アルコキシ基

30 (k) C_{1-4} アルキルカルボニル基及び

(1) ニトロ基からなる群より選択される置換基で置換されている)、

(3) 芳香族ヘテロ環基

(当該芳香族ヘテロ環基は

(a) C_{1-4} アルキル基又は C_{1-4} アルキルカルボニル基で置換されてもよいヘテロ環基、

(b) 水酸基、オキシ基、ハロゲン原子又は C_{1-6} アルキル基で置換されてもよい

5 C_{3-7} シクロアルキル基、

(c) カルボキシ基、

(d) ハロゲン原子、

(e) C_{1-8} アルキル基、

(f) C_{1-4} ハロアルキル基、

10 (g) C_{1-4} アルキルアミノ基、

(h) ジ (C_{1-4} アルキル) アミノ基、

(i) C_{1-6} アルキルチオ基、

(j) C_{1-4} アルコキシ基、

(k) C_{1-4} アルキルカルボニル基及び

15 (l) ハロゲン原子又は C_{1-4} ハロアルキル基で置換されてもよいアリール基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい)、

(4) インダニル基又は

(5) ピペラジニル基

(当該ピペラジニル基は

20 (a) フェニル基、

(b) フェニル C_{1-4} アルキル基、

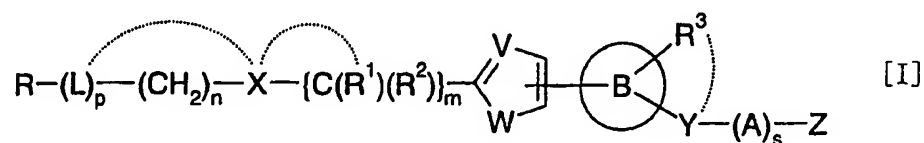
(c) ハロゲン原子で置換されてもよいベンゾイル基及び

(d) フェニル C_{1-4} アルコキシカルボニル基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい) を示す] で示される複素芳香 5 員環化合物若しくはその

25 プロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩。

2. (補正後) 一般式 [I]

一般式 [I]



[式中、

Vは $=N-$ 又は $=CH-$ を示し；

Wは $-S-$ 又は $-O-$ を示し；

mは0、1又は2を示し；

R^1 及び R^2 は、それぞれ独立して、水素原子又は C_{1-4} アルキル基を示し；

- 5 Xは $-N(R^4)-$ 、 $-N(R^5)-CO-O-$ 、 $-SO_2-N(R^5)-$ 、 $-N(R^5)-SO_2-$ 、 $-N(R^6)-SO_2-N(R^5)-$ 、 $-CO-N(R^7)-$ 、 $-N(R^8)-CO-$ 、 $-N(R^9)-CO-N(R^5)-$ 、 $-N(R^{10})-(CH_2)_k-N(R^5)-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 又は $-SO_2-$

(式中、

- 10 kは0又は1乃至4の整数を示し、

R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 及び R^{10} は、それぞれ独立して、

(1)水素原子、

(2) C_{1-6} アルキル基

(当該 C_{1-6} アルキル基は

- 15 (a)置換されてもよいアリール基、

(b)置換されてもよい芳香族ヘテロ環基、

(c)カルボキシ基、

(d) C_{1-4} アルコキシカルボニル基、

(e) $-CO-N(R^{15})(R^{16})$

- 20 (式中、 R^{15} 及び R^{16} は、それぞれ独立して、水素原子、置換されてもよいアリール基、置換されてもよい芳香族ヘテロ環基、 C_{1-6} アルキル基(当該 C_{1-6} アルキル基は置換されてもよいアリール基、置換されてもよい芳香族ヘテロ環基、アリール基で置換されてもよい C_{1-4} アルコキシ基及び置換されてもよいアリールオキシ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい)を示すか、

- 25 又はそれらが結合する窒素原子と一緒にあって、インドリン環を形成してもよく、若しくはさらに窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択される少なくとも1つのヘテロ原子を含有してもよい5乃至7員ヘテロ環を形成してもよい)、

(f) $-N(R^{15})(R^{16})$

- 30 (式中、 R^{15} 及び R^{16} は前記記載の通りである)、

(g) $-O-R^{17}$

(式中、 R^{17} は水素原子、置換されてもよいアリール基、置換されてもよい芳香

族ヘテロ環基又は C_{1-6} アルキル基（当該 C_{1-6} アルキル基は置換されてもよいアリール基、置換されてもよい芳香族ヘテロ環基、アリール基で置換されてもよい C_{1-4} アルコキシ基及び置換されてもよいアリールオキシ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい）を示す）、

5 (h) $-CO-R^{17}$

（式中、 R^{17} は前記記載の通りである）、

(i) $-SO_2-R^{17}$

（式中、 R^{17} は前記記載の通りである）又は

(j) C_{3-7} シクロアルキル基で置換されていてもよい）、

10 (3) $-CO-N(R^{15})(R^{16})$

（式中、 R^{15} 及び R^{16} は前記記載の通りである）、

(4) $-SO_2-N(R^{15})(R^{16})$

（式中、 R^{15} 及び R^{16} は前記記載の通りである）、

(5) $-CO-R^{17}$

15 （式中、 R^{17} は前記記載の通りである）、

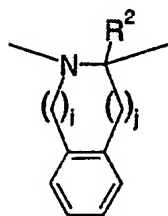
(6) $-SO_2-R^{17}$

（式中、 R^{17} は前記記載の通りである）、

(7) 置換されてもよいアリール基、

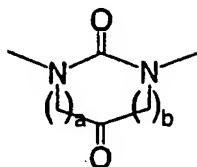
(8) 置換されてもよい芳香族ヘテロ環基を示すか、又は

20 (9) R^4 及び R^1 が一緒になって



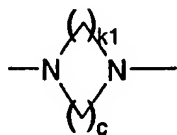
（式中、 i 及び j は、それぞれ独立して、0、1又は2を示し、 R^2 は前記記載の通りである）を形成してもよく、

(10) R^5 及び R^9 が一緒になって



(式中、a 及び b は、それぞれ独立して、0、1 又は 2 を示す) を形成してもよく、

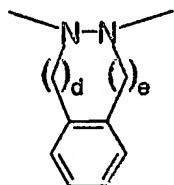
(11) R^5 及び R^{10} が一緒になって



5

(式中、k1 及び c は、それぞれ独立して、0 又は 1 乃至 4 の整数を示す) を形成してもよく、若しくは

(12) R^5 及び R^{10} が一緒になって



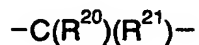
10 (式中、d 及び e は、それぞれ独立して、0、1 又は 2 を示す) を形成してもよい) を示し；

n は 0 又は 1 乃至 4 の整数を示し；

p は 0 又は 1 を示し；

L は

15 (1)



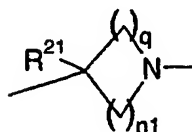
(式中、

R^{20} は

(a) 水素原子、

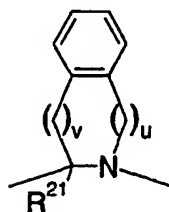
20 (b) C_{1-6} アルキル基を示すか、又は

(c) R^4 と一緒になって



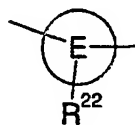
(式中、 $n1$ 及び q は、それぞれ独立して、0 又は 1 乃至 4 の整数を示す) を形成してもよく、若しくは

5 (d) R^4 と一緒になって



(式中、 u 及び v は、それぞれ独立して、0、1 又は 2 を示す) を形成してもよく、

R^{21} は水素原子、 C_{1-6} アルキル基 (当該 C_{1-6} アルキル基は置換されてもよいアリール基又は置換されてもよい芳香族ヘテロ環基で置換されていてもよい)、置換されてもよいアリール基又は置換されてもよい芳香族ヘテロ環基を示す)、
10 (2)



(式中、

15 E はアリール基又は芳香族ヘテロ環基を示し、

R^{22} は

(a) 水素原子、

(b) ハロゲン原子、

(c) C_{1-4} アルキル基、

20 (d) カルボキシ基で置換されてもよい C_{1-4} アルコキシ基、

(e) C_{1-6} アルキルチオ基、

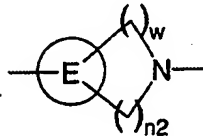
(f) ニトロ基、

(g) $-N(R^{23})(R^{24})$

(式中、 R^{23} 及び R^{24} は、それぞれ独立して、水素原子、 C_{1-6} アルキル基、 C_{1-4} アルキルカルボニル基 (当該 C_{1-4} アルキルカルボニル基はアミノ基、 C_{1-4} アルキルアミノ基又はジ (C_{1-4} アルキル) アミノ基で置換されていてもよい) 又は

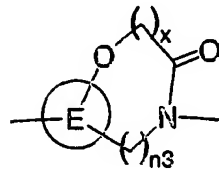
5 C_{1-4} アルキルスルホニル基を示す) を示すか、又は

(h) R^4 と一緒になって



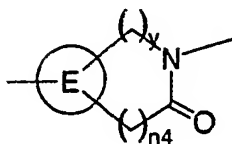
(式中、 n_2 及び w は、それぞれ独立して、0 又は 1 乃至 3 の整数を示し、 E は前記記載の通りである) を形成してもよく、

10 (i) R^4 と一緒になって



(式中、 n_3 及び x は、それぞれ独立して、0 又は 1 を示し、 E は前記記載の通りである) を形成してもよく、

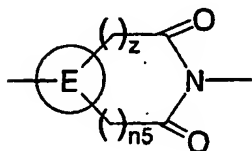
(j) R^7 と一緒になって



15

(式中、 n_4 及び y は、それぞれ独立して、0、1 又は 2 を示し、 E は前記記載の通りである) を形成してもよく、

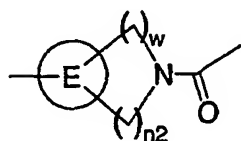
(k) R^7 と一緒になって



20 (式中、 n_5 及び z は、それぞれ独立して、0 又は 1 を示し、 E は前記記載の通

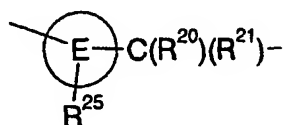
りである)を形成してもよく、若しくは

(1) R^8 と一緒にあって



(式中、 n_2 及び w は、それぞれ独立して、0 又は 1 乃至 3 の整数を示し、E は
5 前記記載の通りである)を形成してもよい) 又は

(3)



(式中、

R^{20} 、 R^{21} 及び E は前記記載の通りであり、

10 R^{25} は

(a) 水素原子、

(b) ハロゲン原子、

(c) C_{1-4} アルキル基、

(d) カルボキシ基で置換されてもよい C_{1-4} アルコキシ基、

15 (e) C_{1-6} アルキルチオ基、

(f) ニトロ基又は

(g) $-N(R^{23})(R^{24})$

(式中、 R^{23} 及び R^{24} は前記記載の通りである)を示し；

R は $-COO(R^{19})$ 、 $-A^1-COO(R^{19})$ 又は $-O-A^1-COO(R^{19})$

20 (式中、 A^1 は C_{1-4} アルキレン基を示し、 R^{19} は水素原子又は C_{1-4} アルキル基を示す)を示し；

B はアリール基又は芳香族ヘテロ環基を示し；

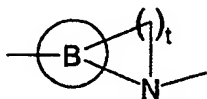
R^3 は

(1) 水素原子、

25 (2) ハロゲン原子、

(3) C_{1-8} アルキル基、

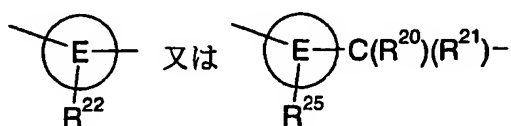
- (4) C_{1-6} アルコキシ基、
- (5) C_{1-6} アルキルアミノ基、
- (6) ジ (C_{1-6} アルキル) アミノ基、
- (7) シアノ基、
- 5 (8) ニトロ基、
- (9) C_{1-4} ハロアルキル基、
- (10) $-S-R^{18}$ (R^{18} は C_{1-6} アルキル基又はアリール基を示す)、
- (11) $-SO-R^{18}$ (R^{18} は C_{1-6} アルキル基又はアリール基を示す) 又は
- (12) $-SO_2-R^{18}$ (R^{18} は C_{1-6} アルキル基又はアリール基を示す) を示し；
- 10 Y は $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-N(R^{11})-$ 、 $-N(R^{12})-C$
 $O-$ 、 $-N(R^{12})-SO_2-$ 、 $-SO_2-N(R^{12})-$ 、 $-C(R^{13})(R^{14})-$ 、
 $-CO-$ 、 $-C(R^{13})(R^{14})-N(R^{12})-$ 、 $-CO-N(R^{12})-$ 又は $-C$
 $(R^{13})(R^{14})-O-$
 (式中、
- 15 R^{11} は
 - (1) 水素原子、
 - (2) C_{1-3} アルキル基
 (当該 C_{1-3} アルキル基は
 - (a) C_{3-7} シクロアルキル基、
 - 20 (b) 置換されてもよいアリール基、
 - (c) 置換されてもよいヘテロ環基、
 - (d) 水酸基、
 - (e) C_{1-4} アルキルアミノ基及び
 - (f) ジ (C_{1-4} アルキル) アミノ基からなる群より選択される置換基で置換され
- 25 ていてもよい)、
- (3) C_{2-4} アルケニル基、
- (4) C_{1-4} アルキルスルホニル基、
- (5) C_{1-4} アルキルカルボニル基
 (当該 C_{1-4} アルキルカルボニル基は水酸基又は C_{1-4} アルコキシ基で置換されて
- 30 いてもよい) を示すか、又は
- (6) R^3 と一緒になって



(式中、 t は 1 乃至 4 の整数を示し、 B は前記記載の通りである) を形成してもよく、

R^{12} は

- 5 (1) 水素原子、
- (2) C_{1-8} アルキル基
(当該 C_{1-8} アルキル基は
 - (a) C_{3-7} シクロアルキル基、
 - (b) 置換されてもよいアリール基、
 - 10 (c) 置換されてもよいヘテロ環基、
 - (d) 水酸基、
 - (e) C_{1-4} アルキルアミノ基及び
 - (f) ジ (C_{1-4} アルキル) アミノ基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい)、
- 15 (3) C_{2-4} アルケニル基、
- (4) C_{1-4} アルキルスルホニル基又は
- (5) C_{1-4} アルキルカルボニル基
(当該 C_{1-4} アルキルカルボニル基は水酸基又は C_{1-4} アルコキシ基で置換されていてもよい) を示し、
- 20 R^{13} 及び R^{14} は、それぞれ独立して、水素原子、 C_{1-4} アルキル基を示すか、又はそれらが結合する炭素原子と一緒になって C_{3-7} シクロアルカンを形成してもよく、若しくはそれらが結合する炭素原子と一緒になって、さらに窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選択される少なくとも 1 つのヘテロ原子を含有してもよい 5 乃至 7 員ヘテロ環を形成してもよい) を示し
- 25 (但し、
 m が 0 であり、 p が 1 であり、 L が



(式中、 R^{20} 及び R^{21} はそれぞれ水素原子を示し、 E はフェニル基を示し、 R^{22} は水素原子、ハロゲン原子、 C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基又はニトロ基を示し、 R^{25} は水素原子、ハロゲン原子、 C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基又はニトロ基を示す) である場合には、

5 Yは、

—C (R^{13}) (R^{14}) —N (R^{12}) —、—CO—N (R^{12}) —又は—C (R^{13}) (R^{14}) —O— (式中、 R^{12} 、 R^{13} 及び R^{14} は前記記載の通りである) である)；

s は0又は1を示し；

Aは C_{3-7} シクロアルキル基で置換されてもよい C_{1-4} アルキレン基を示し；

10 Zは

(1) C_{3-7} シクロアルキル基

(当該 C_{3-7} シクロアルキル基はアリール基 (当該アリール基はハロゲン原子又は C_{1-6} アルキル基で置換されてもよい) 又は芳香族ヘテロ環基 (当該芳香族ヘテロ環基はハロゲン原子又は C_{1-6} アルキル基で置換されてもよい) で置換されていてもよい)、

15 ていてもよい)、

(2) アリール基

(当該アリール基は

(a) C_{1-4} アルキル基又は C_{1-4} アルキルカルボニル基で置換されてもよいヘテロ環基、

20 (b) 水酸基、オキシ基、ハロゲン原子又は C_{1-6} アルキル基で置換されてもよい C_{3-7} シクロアルキル基、

(c) カルボキシ基、

(d) ハロゲン原子、

(e) C_{1-8} アルキル基、

25 (f) C_{1-4} ハロアルキル基、

(g) C_{1-4} アルキルアミノ基、

(h) ジ (C_{1-4} アルキル) アミノ基、

(i) C_{1-6} アルキルチオ基、

(j) C_{1-4} アルコキシ基及び

30 (k) C_{1-4} アルキルカルボニル基からなる群より選択される置換基で置換されている)、

(3) 芳香族ヘテロ環基

(当該芳香族ヘテロ環基は

(a) C_{1-4} アルキル基又は C_{1-4} アルキルカルボニル基で置換されてもよいヘテロ環基、

(b) 水酸基、オキシ基、ハロゲン原子又は C_{1-6} アルキル基で置換されてもよい

5 C_{3-7} シクロアルキル基、

(c) カルボキシ基、

(d) ハロゲン原子、

(e) C_{1-8} アルキル基、

(f) C_{1-4} ハロアルキル基、

10 (g) C_{1-4} アルキルアミノ基、

(h) ジ (C_{1-4} アルキル) アミノ基、

(i) C_{1-6} アルキルチオ基、

(j) C_{1-4} アルコキシ基、

(k) C_{1-4} アルキルカルボニル基及び

15 (1) ハロゲン原子又は C_{1-4} ハロアルキル基で置換されてもよいアリール基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい)、

(4) インダニル基又は

(5) ピペラジニル基

(当該ピペラジニル基は

20 (a) フェニル基、

(b) フェニル C_{1-4} アルキル基、

(c) ハロゲン原子で置換されてもよいベンゾイル基及び

(d) フェニル C_{1-4} アルコキシカルボニル基からなる群より選択される置換基で置換されていてもよい) を示す] で示される請求項 1 記載の複素芳香 5 員環化合物

25 物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩。

3. 一般式 [I] において、

R^3 は

(1) 水素原子、

(2) ハロゲン原子、

30 (3) C_{1-6} アルキル基又は

(4) C_{1-4} アルコキシ基を示し；

Y は $-O-$ 、 $-N(R^{11})-$ 、 $-N(R^{12})-CO-$ 、 $-C(R^{13})(R^{14})-$ 、 $-$

条約第 19 条 (1) に基づく説明書

請求項 1 において、当該請求項に係る発明の引用文献 (JP 2003-511416 A、WO 02/083656 A2) に記載された発明に対する新規性を明確にするために、一般式 (I) 中の基 Z 中の (2) アリール基について、当該アリール基が (a) ~ (l) からなる群より選択される置換基で「置換されている」を「置換されている」とする補正を行った。

請求項 1 の上記の補正に伴い、当該請求項に従属する請求項 2 において、一般式 (I) 中の基 Z 中の (2) アリール基について、当該アリール基が (a) ~ (k) からなる群より選択される置換基で「置換されている」を「置換されている」とする補正を行った。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2004/005119

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl.⁷ C07D263/32, 417/14, 333/20, 413/12, 417/06, 409/12, 333/38,
333/16, 333/18, 277/22, 277/28, 417/12, A61K31/421, 31/4439,
31/4725, 31/538, 31/497, 31/4184, 31/427, 31/428, 31/381,

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl.⁷ C07D263/32, 417/14, 333/20, 413/12, 417/06, 409/12, 333/38,
333/16, 333/18, 277/22, 277/28, 417/12, A61K31/421, 31/4439,
31/4725, 31/538, 31/497, 31/4184, 31/427, 31/428, 31/381,

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

REGISTRY (STN), CAPLUS (STN), CAOLD (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X A	JP 2003-511416 A (SOCIETE DE CONSEILS DE RECHERCHES ET D'APPLICATIONS SCIENTIFIQUES SCRAS), 25 March, 2003 (25.03.03), Par. No. [0304] & WO 01/26656 A2 & FR 2799461 A1 & BR 2000014649 A & EP 1223933 A2 & EP 1228760 A2 & NO 2002001689 A	1 2-106
X A	WO 02/083656 A2 (SOCIETE DE CONSEILS DE RECHERCHES ET D'APPLICATIONS SCIENTIFIQUES), 24 October, 2002 (24.10.02), Example 19 & FR 2823208 A1 & EP 1379514 A2 & NO 2003004524 A	1 2-106

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C.☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:	"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance	"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date	"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)	"&" document member of the same patent family
"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means	
"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed	

Date of the actual completion of the international search
25 June, 2004 (25.06.04)

Date of mailing of the international search report
27 July, 2004 (27.07.04)

Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2004/005119

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	JP 2002-114768 A (Japan Tobacco Inc.), 16 April, 2002 (16 04.02), (Family: none)	1-106
A	JP 2002-514633 A (American Home Products Corp.), 21 May, 2002 (21.05.02), & WO 99/58514 A1 & EP 1077960 A1 & CA 2330558 A	1-106

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2004/005119

Box No. II Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 2 of first sheet)

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. ☐ Claims Nos.:
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:

2. ☐ Claims Nos.:
because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:

3. ☐ Claims Nos.:
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

Box No. III Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 3 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

See extra sheet.

1. ☐ As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2. ☐ As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
3. ☐ As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:

4. ☒ No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.: 1-106.

Remark on Protest

- ☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.
☐ No protest accompanied the payment of additional search fees.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2004/005119

Continuation of Box No.III of continuation of first sheet(2)

The "receptor type tyrosine kinase negative regulatory factor" appearing in claims 107-111 is tyrosine phosphatase 1B (PTP1B), and combining a PTP1B inhibitor with a second curative medicine was publicly known before the filing of this application (for example, see JP 2002-526505 A, WO 01/070754 A1, etc.). Further, the compounds of the general formula [II] of this application were publicly known before the filing of this application (for example, see JP 7-196646 A, Tetrahedron Letters, 1999, Vol. 40, p.4769-4773, etc.).

Thus,

1) the special technical feature of the invention claimed in claims 1-106 is the compound of the general formula [I];

2) the special technical feature of the invention claimed in claim 107 is a combination of a PTP1B inhibitor with a curative medicine for hyperlipemia;

3) the special technical feature of the invention claimed in claim 108 is a combination of a PTP1B inhibitor with a curative medicine for diabetes mellitus;

4) the special technical feature of the invention claimed in claim 109 is a combination of a PTP1B inhibitor with a curative medicine for obesity;

5) the special technical feature of the invention claimed in claim 110 is a combination of a PTP1B inhibitor with a curative medicine for hypertension;

6) the special technical feature of the invention claimed in claim 111 is a combination of a PTP1B inhibitor with a curative medicine for thrombosis; and

7) the special technical feature of the invention claimed in claim 112 is the compound of the general formula [II].

Therefore, among the inventions 1) to 7) above, there is no technical relationship involving one or more of the same or corresponding special technical features. Consequently, it does not appear that these inventions are linked with each other so as to form a single general inventive concept.

<Subject of search>

Claims 1 and 2 comprehend a vast plurality of compounds. However, only some of the claimed compounds are supported by the description within the meaning of PCT Article 6 and disclosed therein within the meaning of PCT Article 5.

Therefore, the search has been conducted only on those supported by the description and disclosed therein, namely, those wherein the pentacycle containing V and W is thiophene, thiazole or oxazole.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2004/005119

Continuation of A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
(International Patent Classification (IPC))

Int.Cl⁷ 31/405, 31/4155, 31/423, 45/00, A61P43/00, 3/10, 3/06, 3/04

(According to International Patent Classification (IPC) or to both national
classification and IPC)

Continuation of B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (International Patent Classification (IPC))

Int.Cl⁷ 31/405, 31/4155, 31/423, 45/00, A61P43/00, 3/10, 3/06, 3/04

Minimum documentation searched (classification system followed by
classification symbols)

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC)) Int. Cl ⁷ C07D263/32, 417/14, 333/20, 413/12, 417/06, 409/12, 333/38, 333/16, 333/18, 277/22, 277/28, 417/12, A61K31/421, 31/4439, 31/4725, 31/538, 31/497, 31/4184, 31/427, 31/428, 31/381, 31/405, 31/4155, 31/423, 45/00, A61P43/00, 3/10, 3/06, 3/04		
B. 調査を行った分野 調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC)) Int. Cl ⁷ C07D263/32, 417/14, 333/20, 413/12, 417/06, 409/12, 333/38, 333/16, 333/18, 277/22, 277/28, 417/12, A61K31/421, 31/4439, 31/4725, 31/538, 31/497, 31/4184, 31/427, 31/428, 31/381, 31/405, 31/4155, 31/423, 45/00, A61P43/00, 3/10, 3/06, 3/04		
最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの		
国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語) REGISTRY (STN), CAPLUS (STN), CAOLD (STN)		
C. 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X A	JP 2003-511416 A (ソシエ・ト・コンセユ・ト・ルシエル・エ・エ・タツブ・リカーション・シャン ティフィク) 2003.03.25 【0304】参照 & WO 01/26656 A2 & FR 2799461 A1 & BR 2000014649 A & EP 1223933 A2 & EP 1228760 A2 & NO 2002001689 A	1 2-106
X A	WO 02/083656 A2 (SOCIETE DE CONSEILS DE RECHERCHES ET D'APPL ICATIONS SCIENTIFIQUES) 2002.10.24 Exemple 19参照 & FR 2823208 A1 & EP 1379514 A2 & NO 2003004524 A	1 2-106
<input checked="" type="checkbox"/> C欄の続きにも文献が列挙されている。 <input type="checkbox"/> パテントファミリーに関する別紙を参照。		
* 引用文献のカテゴリー 「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの 「E」 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの 「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行人若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す) 「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献 「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願日の後に公表された文献 「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの 「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの 「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの 「&」 同一パテントファミリー文献		
国際調査を完了した日 25.06.2004		国際調査報告の発送日 27.7.2004
国際調査機関の名称及びあて先 日本国特許庁 (ISA/J P) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号		特許庁審査官 (権限のある職員) 中木 亜希 4 P 9282 電話番号 03-3581-1101 内線 3492

C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
A	JP 2002-114768 A (日本たばこ産業株式会社) 2002.04.16 (ファミリーなし)	1-106
A	JP 2002-514633 A (アメリカン・ホーム・プロダクツ・コーポレーション) ¹ 2002.05.21 & WO 99/58514 A1 & EP 1077960 A1 & CA 2330558 A	1-106

第Ⅱ欄 請求の範囲の一部の調査ができないときの意見 (第1ページの2の続き)

法第8条第3項 (PCT 17条(2)(a)) の規定により、この国際調査報告は次の理由により請求の範囲の一部について作成しなかった。

1. ☐ 請求の範囲 _____ は、この国際調査機関が調査をすることを要しない対象に係るものである。
つまり、
2. ☐ 請求の範囲 _____ は、有意義な国際調査をすることができる程度まで所定の要件を満たしていない国際出願の部分に係るものである。つまり、
3. ☐ 請求の範囲 _____ は、従属請求の範囲であってPCT規則6.4(a)の第2文及び第3文の規定に従って記載されていない。

第Ⅲ欄 発明の単一性が欠如しているときの意見 (第1ページの3の続き)

次に述べるようにこの国際出願に二以上の発明があるとこの国際調査機関は認めた。

特別ページ参照

1. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料をすべて期間内に納付したので、この国際調査報告は、すべての調査可能な請求の範囲について作成した。
2. ☐ 追加調査手数料を要求するまでもなく、すべての調査可能な請求の範囲について調査することができたので、追加調査手数料の納付を求めなかった。
3. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料を一部のみしか期間内に納付しなかったので、この国際調査報告は、手数料の納付のあった次の請求の範囲のみについて作成した。
4. ☒ 出願人が必要な追加調査手数料を期間内に納付しなかったので、この国際調査報告は、請求の範囲の最初に記載されている発明に係る次の請求の範囲について作成した。

請求の範囲 1-106

追加調査手数料の異議の申立てに関する注意

- ☐ 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがあった。
☒ 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがなかった。

第 I I I 欄の続き

請求の範囲 107-111 に記載の「受容体型チロシンキナーゼネガティブ調節因子」は、チロシンホスファターゼ 1B (PTP1B) であり、PTP1B 阻害剤と第 2 の治療薬を組み合わせることは本願出願前において公知である (例えば、JP 2002-526505 A、WO 01/070754 A1 等を参照。)。また、本願一般式 [I I] で表される化合物も、本願出願前に公知である (例えば、JP 7-196646 A、Tetrahedron Letters, 1999, Vol. 40, p. 4769-4773 等を参照。)。)

してみると、

- 1) 請求の範囲 1-106 に記載された発明の特別な技術的特徴は、一般式 [I] で表される化合物にあり、
- 2) 請求の範囲 107 に記載された発明の特別な技術的特徴は、PTP1B 阻害薬と高脂血症治療薬とを組み合わせることにあり、
- 3) 請求の範囲 108 に記載された発明の特別な技術的特徴は、PTP1B 阻害薬と糖尿病治療薬とを組み合わせることにあり、
- 4) 請求の範囲 109 に記載された発明の特別な技術的特徴は、PTP1B 阻害薬と肥満症治療薬とを組み合わせることにあり、
- 5) 請求の範囲 110 に記載された発明の特別な技術的特徴は、PTP1B 阻害薬と高血圧症治療薬とを組み合わせることにあり、
- 6) 請求の範囲 111 に記載された発明の特別な技術的特徴は、PTP1B 阻害薬と血栓症治療薬とを組み合わせることにあり、
- 7) 請求の範囲 112 に記載された発明の特別な技術的特徴は、一般式 [I I] で表される化合物にある。

したがって、上記 1) ~ 7) の発明は、一又は二以上の同一又は対応する特別な技術的特徴を含む技術的な関係にないから、単一の一般的発明概念を形成するように連関しているものとは認められない。

<調査の対象について>

請求の範囲 1 及び 2 は、非常に多数の化合物を包含している。しかしながら、PCT 6 条の意味において明細書に裏付けられ、また、PCT 5 条の意味において開示されているのは、クレームされた化合物のごくわずかな部分にすぎない。

よって、調査は、明細書に裏付けられ、開示されている部分、すなわち、V 及び W を含む 5 員環がチオフェン、チアゾール及びオキサゾールのものについて行った。

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning
Operations and is not part of the Official Record**

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- ☐ BLACK BORDERS
- ☐ IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- ☒ FADED TEXT OR DRAWING
- ☒ BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING
- ☐ SKEWED/SLANTED IMAGES
- ☐ COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS
- ☐ GRAY SCALE DOCUMENTS
- ☒ LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT
- ☒ REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY
- ☐ OTHER: _____

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.

THIS PAGE BLANK (USPTO)